



(19)

Europäisches Patentamt

European Patent Office

Office européen des brevets



(11)

EP 1 155 698 A1

(12)

**EUROPEAN PATENT APPLICATION**  
published in accordance with Art. 158(3) EPC

(43) Date of publication:  
21.11.2001 Bulletin 2001/47

(51) Int Cl.7: A61K 31/69, A61P 33/02,  
C07F 5/02

(21) Application number: 99959910.3

(86) International application number:  
PCT/JP99/07139

(22) Date of filing: 20.12.1999

(87) International publication number:  
WO 00/44387 (03.08.2000 Gazette 2000/31)

(84) Designated Contracting States:  
AT BE CH CY DE DK ES FI FR GB GR IE IT LI LU  
MC NL PT SE

- FUJIKAWA, Masazumi  
Nara-shi, Nara 630-8024 (JP)
- HAYASE, Yoshio  
Kameyama-shi, Mie 519-0105 (JP)
- KAWAGUCHI, Harumoto  
Ayama-gun, Mie 519-1402 (JP)

(30) Priority: 29.01.1999 JP 2182299

(71) Applicants:  

- Nitto Kasei Co., Ltd.  
Osaka-shi, Osaka 533-0031 (JP)
- SHIONOGI & CO., LTD.  
Osaka-shi, Osaka 541-0045 (JP)

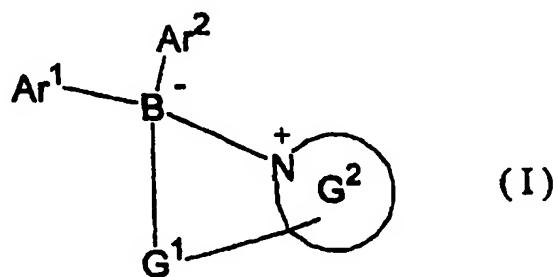
(74) Representative:  
 Baverstock, Michael George Douglas et al  
 BOULT WADE TENNANT,  
 Verulam Gardens  
 70 Gray's Inn Road  
 London WC1X 8BT (GB)

(72) Inventors:  

- IMAZAKI, Hideyuki  
Mishima-gun, Osaka 618-0024 (JP)

(54) **ORGANOBORON COMPOUNDS EXHIBITING ANTICOCCIDIAL ACTIVITIES**

(57) The present invention provides a pharmaceutical composition useful for animals except for humans, a pharmaceutical composition for use as an antiprotozoal agent, and a pharmaceutical composition for use as an anticoccidial agent, which comprises a compound of formula (I):



in which Ar<sup>1</sup> and Ar<sup>2</sup> are independently a cyclic group which may be optionally substituted; G<sup>1</sup> is a group of the formula: -A-, -A-CR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>- or -A-CR<sup>3</sup>R<sup>4</sup>-CR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>-; G<sup>2</sup> is an azacyclic group which may be optionally substituted; provided that the nitrogen atom in the ring is bound to B; and the ring constituted with B, G<sup>1</sup> and G<sup>2</sup> is a 5- or 6-membered ring; or a salt thereof or a hydrate of them.

EP 1 155 698 A1

**Description****FIELD OF THE INVENTION**

- 5 [0001] The invention belongs to the veterinary field, and relates to novel pharmaceutical compositions for animals except humans, antiprotozoal agents, and anticoccidial agents. Specifically, the invention relates to a composition comprising an organic boron-based compound, and the compound itself.

**BACKGROUND ART**

- 10 [0002] Coccidiosis is an infection disease caused by coccidia, a subclass of protozoa (Sporozoa of Apicomplexa class). A coccidia, *Eimeria tenella*, *Eimeria acervulina*, and *Eimeria necatrix* or the like infects mainly poultry, and induces various symptoms such as enterohemorrhage, death or growth inhibition in poultry. Outbreaks of widespread coccidiosis in poultry farms wherein poultry such as chicken and duck are commercially bred cause excessive losses, 15 and are usually critical. Thus, there is an interest in anticoccidial agents useful for the prevention or treatment of coccidiosis.

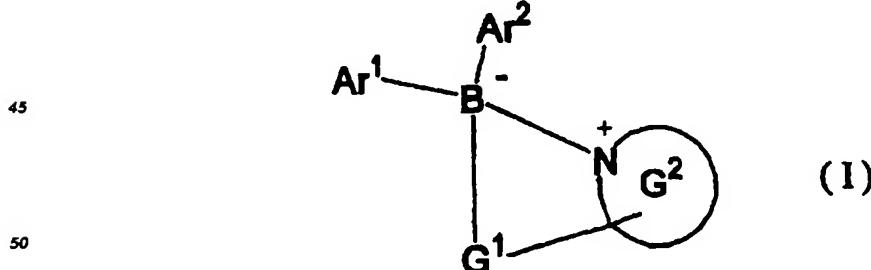
**RELATIVE ART AND PROBLEMS TO BE SOLVED BY THE INVENTION**

- 20 [0003] Previously, sulfonamids, nitrofurans, quinolines, antithiamines, and benzamides have been in practical use as anticoccidial agents, and nowadays polyether antibiotics such as salinomycin and clopidol are primarily used. However, these agents are not so potent in anticoccidial effects, and are problematically toxic to hosts. Further, drug tolerant strains occur due to their long period use, and cause gradual decrease in potency. Such a situation brings about a demand to develop a new type of anticoccidial agent for poultry which is effective against drug tolerant strains and 25 which resists drug tolerance.
- [0004] As a result of an amount of research, the present inventors found organic boron-based compounds that overcome the drawbacks in the art as shown above, exhibit a good anticoccidial effect, and prevent outbreaks of coccidiosis.
- [0005] For organic boron-based compounds, Farfan, Norberto et al., *J. Chem. Soc., Perkin Trans. 2* (1992), (4), 527-32 describes diphenyl (2-pyridylalkyloxy-O,N) borons and their preparation, and Vershbitskii, F. R. et al., *Term. Anal. Fazovye Ravnovesiya* (1985), 31-3 describes organic boron-based compounds intramolecularly coordinated. However, no use of these compounds is described therein. Further, Lin, Kai et al., *Yiyao Gongye* (1985), 16(11), 500-2 describes that (p-fluorophenyl) (o-methoxyphenyl) borinate and 8-hydroxyquinoline are reacted each other to give a boron-containing cyclic group compound, which has anti-tumor activities. However, any anticoccidial effect is not described therein.

**Solution for solving the problems**

35 [0006] Thus, the present invention encompasses a pharmaceutical composition useful for animals except for humans, an antiprotozoal or an anticoccidial, which comprises a compound of formula (I):

40



45 in which

50

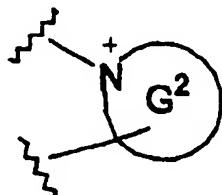
55 Ar<sup>1</sup> and Ar<sup>2</sup> are independently a cyclic group which may be optionally substituted; G<sup>1</sup> is a group of the formula: -A-, -A-CR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>- or -A-CR<sup>3</sup>R<sup>4</sup>-CR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>- wherein A is an oxygen atom or a sulfur atom, R<sup>1</sup>-R<sup>6</sup> are the same or different, and are each a hydrogen atom, a halogen atom, hydroxy, an aliphatic hydrocarbon

group which may be optionally substituted, a-O- (aliphatic hydrocarbon group which may be optionally substituted), an acyloxy, a phenoxy which may be optionally substituted, an amino group which may be optionally substituted, a sulfo group which may be optionally substituted, or an aryl which may be optionally substituted, or R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> and R<sup>4</sup> and/or R<sup>5</sup> and R<sup>6</sup> are combined together to form oxo, a methylene which may be optionally substituted, or an imino which may be optionally substituted; and

a group of the formula:

10

15



20 is an azacyclic group that may be optionally substituted;  
provided that the smallest ring among rings constructed with B<sup>-</sup>, G<sup>1</sup> and G<sup>2</sup> is a 5- or 6-membered ring; or a salt thereof or a hydrate of them.

[0007] In other aspects, the present invention encompasses the compounds as shown below of the compounds of formula (I):

25

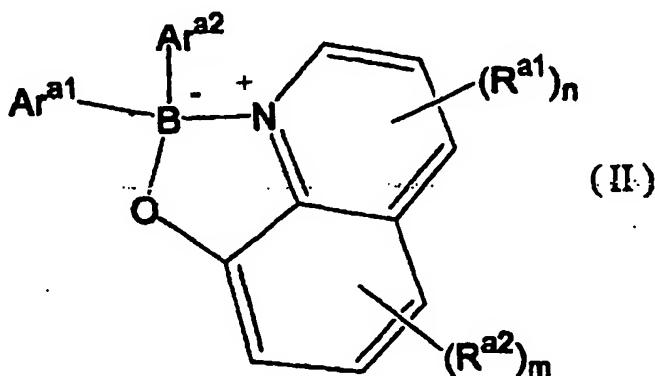
1) A compound of formula (II):

30

35

40

45



in which

Ar<sup>a1</sup> is an aryl which may be optionally substituted;

Ar<sup>a2</sup> is a fused aryl which may be optionally substituted;

50 R<sup>a1</sup> and R<sup>a2</sup> are independently hydrogen atom, a halogen atom, a lower alkyl, a lower alkenyl, a halogenated lower alkyl, a halogenated lower alkenyl, an aralkyl which may be optionally substituted, hydroxy, a lower alkoxy, a lower alkenyloxy, a halogenated lower alkoxy, a halogenated lower alkenyloxy, an acyloxy, phenoxy which may be optionally substituted, an aralkyloxy which may be optionally substituted, an amino group which may be optionally substituted, a sulfo group which may be optionally substituted, or an aryl which may be optionally substituted; and

55 n and m are the same or different, and are an integer of 0-3;

provided that when both n and m are 0, then a compound wherein both Ar<sup>a1</sup> and Ar<sup>a2</sup> are not naphthalen-

2-yl substituted at the 1-position by naphthalen-1-yl; or a salt thereof or a hydrate of them;  
 2) A compound of formula (III):

5

10

15

20

25

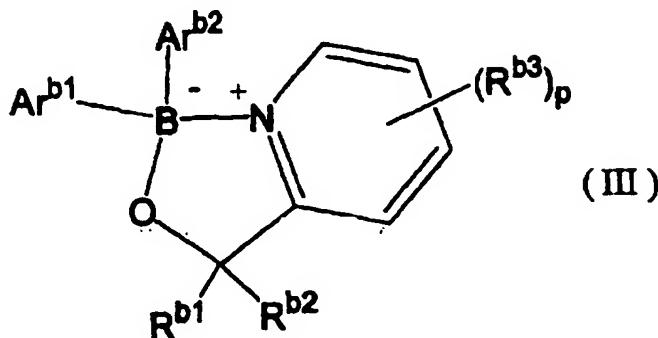
30

35

45

50

55



in which

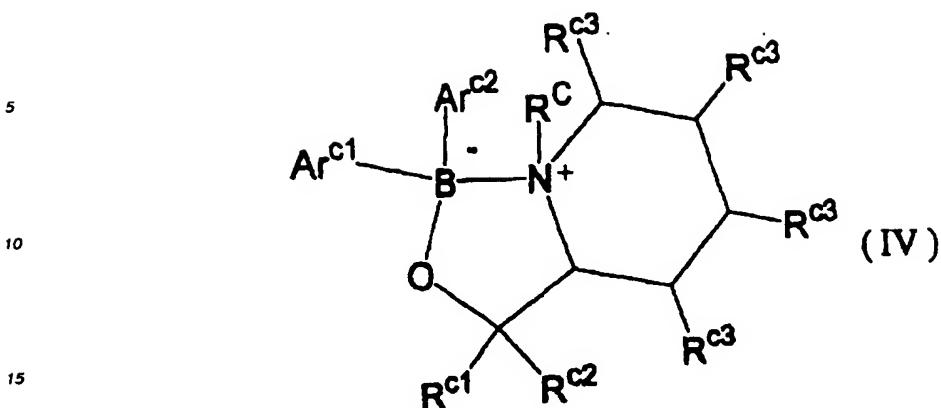
Ar<sup>b1</sup> and Ar<sup>b2</sup> are the same or different, and are an aryl which may be optionally substituted;  
 R<sup>b1</sup> and R<sup>b2</sup> are independently a hydrogen atom, a halogen atom, a lower alkyl, a lower alkenyl, a halogenated lower alkyl, a halogenated lower alkenyl, an aralkyl which may be optionally substituted, hydroxy, a lower alkoxy, a lower alkenyloxy, a halogenated lower alkoxy, a halogenated lower alkenyloxy, an acyloxy, phenoxy which may be optionally substituted, an aralkyloxy which may be optionally substituted, an amino group which may be optionally substituted, a sulfo group which may be optionally substituted, or an aryl which may be optionally substituted, or R<sup>b1</sup> and R<sup>b2</sup> are combined together to form an oxo, a methylene which may be optionally substituted or an imino which may be optionally substituted;

R<sup>b3</sup> is each a halogen atom, a lower alkyl, a lower alkenyl, a halogenated lower alkyl, a halogenated lower alkenyl, an aralkyl which may be optionally substituted, hydroxy, a lower alkoxy, a lower alkenyloxy, a halogenated lower alkoxy, a halogenated lower alkenyloxy, an acyloxy, phenoxy which may be optionally substituted, an aralkyloxy which may be optionally substituted, an amino group which may be optionally substituted, a sulfo group which may be optionally substituted, or an aryl which may be optionally substituted, or may be bonded with the adjacent group to form a fused ring; and

p is an integer of 0-4;

provided that when p is 0, both R<sup>b1</sup> and R<sup>b2</sup> are hydrogen, and Ar<sup>b1</sup> and Ar<sup>b2</sup> is a phenyl substituted with a halogen atom or a lower alkyl, then the phenyl of Ar<sup>b1</sup> and Ar<sup>b2</sup> is additionally substituted with a substituent other than a halogen atom or a lower alkyl; or a salt thereof or a hydrate of them;

3) A compound of formula (IV):



20 in which

Ar<sup>c1</sup> and Ar<sup>c2</sup> are independently a cyclic group which may be optionally substituted;  
 R<sup>c1</sup> and R<sup>c2</sup> are independently a hydrogen atom, a halogen atom, a lower alkyl, a lower alkenyl, a halogenated lower alkyl, a halogenated lower alkenyl, an aralkyl which may be optionally substituted, hydroxy, a lower alkoxy, a lower alkenyloxy, a halogenated lower alkoxy, a halogenated lower alkenyloxy, an acyloxy, phenoxy which may be optionally substituted, an aralkyloxy which may be optionally substituted, an amino group which may be optionally substituted, a sulfo group which may be optionally substituted, or an aryl which may be optionally substituted, or R<sup>c1</sup> and R<sup>c2</sup> are combined together to form an oxo, a methylene which may be optionally substituted or an imino which may be optionally substituted;

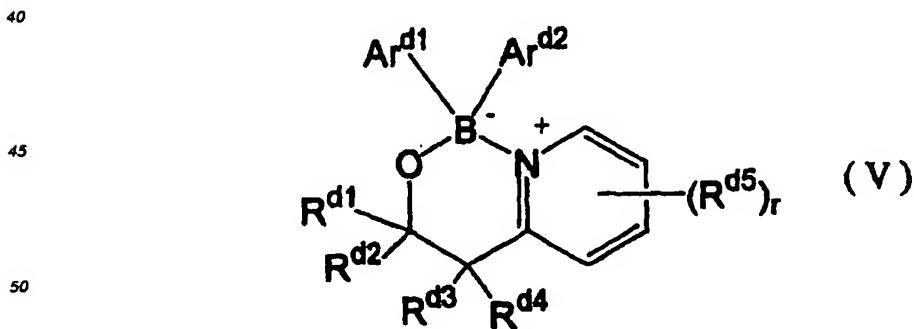
25

R<sup>c3</sup> is each a hydrogen atom, a halogen atom, a lower alkyl, a lower alkenyl, a halogenated lower alkyl, a halogenated lower alkenyl, an aralkyl which may be optionally substituted, hydroxy, a lower alkoxy, a lower alkenyloxy, a halogenated lower alkoxy, a halogenated lower alkenyloxy, an acyloxy, phenoxy which may be optionally substituted, an aralkyloxy which may be optionally substituted, an amino group which may be optionally substituted, a sulfo group which may be optionally substituted, or an aryl which may be optionally substituted, or may be combined with the adjacent group to form a fused ring; and

30

35 R<sup>c</sup> is a hydrogen atom or a lower alkyl; or a salt thereof or a hydrate of them; and

4) A compound of formula (V):



in which

55 Ar<sup>d1</sup> and Ar<sup>d2</sup> are the same or different, and are an aryl which may be optionally substituted;  
 R<sup>d1</sup>, R<sup>d2</sup>, R<sup>d3</sup>, and R<sup>d4</sup> are independently a hydrogen atom, a halogen atom, a lower alkyl, a lower alkenyl, a halogenated lower alkyl, a halogenated lower alkenyl, an aralkyl which may be optionally substituted, hydroxy,

a lower alkoxy, a lower alkenyloxy, a halogenated lower alkoxy, a halogenated lower alkenyloxy, an acyloxy, phenyloxy which may be optionally substituted, an aralkyloxy which may be optionally substituted, an amino group which may be optionally substituted, a sulfo group which may be optionally substituted, or an aryl which may be optionally substituted, or R<sup>d1</sup> and R<sup>d2</sup> and/or R<sup>d3</sup> and R<sup>d4</sup> are combined together to form an oxo, a methylene which may be optionally substituted or an imino which may be optionally substituted;

5 R<sup>d5</sup> is each a halogen atom, a lower alkyl, a lower alkenyl, a halogenated lower alkyl, a halogenated lower alkenyl, an aralkyl which may be optionally substituted, hydroxy, a lower alkoxy, a lower alkenyloxy, a halogenated lower alkoxy, a halogenated lower alkenyloxy, an acyloxy, phenyloxy which may be optionally substituted, an aralkyloxy which may be optionally substituted, an amino group which may be optionally substituted, a sulfo group which may be optionally substituted, or an aryl which may be optionally substituted, or may be combined with the adjacent group to form a fused ring; and  
r is an integer of 0-4;

10 provided that when r is 0, all of R<sup>d1</sup>, R<sup>d2</sup>, R<sup>d3</sup> and d<sup>d4</sup> are hydrogen, and Ar<sup>d1</sup> and Ar<sup>d2</sup> are phenyl substituted with a halogen atom or a lower alkyl, then the phenyl of Ar<sup>d1</sup> and Ar<sup>d2</sup> is additionally substituted with a substituent other than a halogen atom or a lower alkyl; or a salt thereof or a hydrate of them.

15 [0008] In the formulae, the term "a cyclic group which may be optionally substituted" represented by Ar<sup>1</sup> and Ar<sup>2</sup> refers to, for example, monocyclic or fused polycyclic alicyclic hydrocarbon groups (for example, a cycloalkyl which may be optionally substituted, a cycloalkenyl which may be optionally substituted, a cycloalkadienyl which may be optionally substituted, etc.), monocyclic or fused polycyclic aromatic hydrocarbon groups (for example, an aryl which may be optionally substituted, etc.), monocyclic or fused polycyclic heterocyclic groups (for example, an aromatic heterocyclic which may be optionally substituted, etc.), or spiro-cyclic hydrocarbon group or heterocyclic groups.

20 [0009] Preferably, Ar<sup>1</sup> and Ar<sup>2</sup> are the same.

25 [0010] Examples of cycloalkyl as shown above include, for example, a cycloalkyl having 3 to 20 carbon atoms such as cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, cycloheptyl, cyclooctyl, bicyclo[2.2.1]heptyl, bicyclo[2.2.2]octyl, bicyclo[3.2.1]octyl, bicyclo[3.2.2]nonyl, bicyclo[3.3.1]nonyl, bicyclic[4.2.1]nonyl, bicyclo[4.3.1]decyl, and adamantyl, or the like.

30 [0011] Examples of cycloalkenyl as shown above include, for example, a cycloalkenyl having 4 to 20 carbon atoms such as 2-cyclopenten-1-yl, 3-cyclopenten-1-yl, 2-cyclohexen-1-yl, and 3-cyclohexen-1-yl or the like.

35 [0012] Examples of cycloalkadienyl as shown above include, for example, a cycloalkadienyl having 4 to 20 carbon atoms such as 2,4-cyclopentadien-1-yl, 2,4-cyclohexadien-1-yl, and 2,5-cyclohexadien-1-yl or the like.

[0013] Examples of "aryl" as shown above include, for example, an aryl having 6 to 20 carbon atoms such as phenyl, indenyl, naphthyl (1-naphthyl, 2-naphthyl, etc.), anthryl, phenanthryl, acenaphthyl, fluorenyl (9-fluorenyl, 1-fluorenyl, etc.), or the like.

40 [0014] The term "heterocyclic group" as shown above refers to a heterocyclic group containing at least one heteroatom of oxygen, sulfur, nitrogen as an atom constructing the ring, and include monocyclic heterocyclic groups or fused polycyclic heterocyclic groups.

[0015] Specific examples of monocyclic heterocyclic groups include isoxazolyl, isothiazolyl, imidazolyl, 1,2,3-oxadiazolyl, 1,3,4-oxadiazolyl, oxazolyl, furazanyl, 1,2,3-thiadiazolyl, 1,2,4-thiadiazolyl, 1,3,4-thiadiazolyl, thiazolyl, thietyl, tetrazolyl, triazinyl, 1,2,3-triazolyl, 1,2,4-triazolyl, pyranyl, pyrazinyl, pyrazolyl, pyridyl, pyridazinyl, pyrimidinyl, pyrrolyl, 2H-pyrrolyl, furazanyl, furyl or the like.

45 [0016] Specific examples of fused polycyclic heterocyclic groups include acridinyl, 5-azabenzo[a]anthracenyl, isoindolyl, isoquinolyl, isochromanyl, isobenzofranyl, imidazo[2,1-b]thiazolyl, 4H-imidazo[4,5-d]thiazolyl, imidazo[1,2-b] [1,2,4]triazinyl, imidazo[1,2-a]pyridyl, imidazo[1,5-a]pyridyl, imidazo[1,2-b]pyridadinyl, imidazo[1,2-a]pyrimidinyl, imidazolidinyl, imidazolinyl, 1H-indazolyl, indolizinyl, indoly, 4H-[1,3]-oxathioro[5,4-b]pyrrolyl, 1H-2-oxapyrenyl, carbazolyl,  $\alpha$ -carbolinyl,  $\beta$ -carbolinyl,  $\gamma$ -carbolinyl, quinazolinyl, quinoxalinyl, quinolyl, chromanyl, 4H-1,3-dioxolo[4,5-b]imidazolyl, cyclopent[b]pyranyl, 2,3-dithia-1,5-diazaindanyl, 4H-1,3-dithianaphthalenyl, 1,4-dithianaphthalenyl, cinnonyl, thianthrenyl, thieno[2,3-b]franyl, 2,7,9-triazaphenanthrenyl, 1,2,4-triazolo[4,3-a]pyridadinyl, 1,2,4-triazolo[4,3-a]pyridyl, 2,4,6-trithia-3a,7a-diazaindanylneophthyridinyl, piperazinyl, piperidyl, pyrazolidinyl, 7H-pyrazino[2,3-c]carbazolyl, pyrazino[2,3-d]pyridazinyl, 1H-pyrazolo[4,3-d]oxazolyl, pyrazolo[1,5-a]pyridyl, pyrido[1',2':1,2]imidazo[4,5-b]quinoxalinyl, 5H-pyrido[2,3-d]o-oxazinyl, 4H-pyrido[2,3-c]carbazolyl, pyrrolidinyl, pyrrolinyl, 1H-pyrrolo[1,2-b][2]benzazepinyl, pyrrolo[1,2-b]pyridazinyl, phenazinyl, phenathridinyl, phenathrolinyl, phenoxazinyl, phenoxthiinyl, phenothiazinyl, phthalazinyl, pteridinyl, purinyl, 2H-furo[3,2-b]pyranyl, furo[3,4-c]cinnolinyl, 1,2-benzolisoazolyl, benzo[h]isoquinolyl, 1,2-benzolisoazolyl, benzimidazolyl, benzoxazolyl, 4H-3,1-benzoxazinyl, 3-benzoxepinyl, benzothiazolyl, benzo[b]thienyl, 1H-benzotriazolyl, benzo[b]franyl, morpholinyl, or the like.

50 [0017] Preferred groups of "a cyclic group which may be optionally substituted" represented by Ar<sup>1</sup> and Ar<sup>2</sup> include an aryl which may be optionally substituted, and specifically an aryl which may be optionally substituted with a halogen

atom, a lower alkyl, a lower alkenyl, a lower alkoxy, a halogenated lower alkyl, a halogenated lower alkoxy, hydroxy, an acyl, or an amino, or the like. The number of the substituents on an aryl or a heterocyclic group of Ar<sup>1</sup> and Ar<sup>2</sup> is not limited to one, and the species is not also limited to one.

[0018] Typical specific examples of an aryl which may be optionally substituted with one species of the substituent are described below.

[0019] The term "halogen atom" refers to fluorine, chlorine, bromine, or the like.

- [0020] Thus, examples of an aryl substituted with the halogen atom include 2-halogenatedphenyl (for example, 2-fluorophenyl, 2-chlorophenyl, 2-bromophenyl, etc.), 3-halogenatedphenyl (for example, 3-fluorophenyl, 3-chlorophenyl, 3-bromophenyl, etc.), 4-halogenatedphenyl (for example, 4-fluorophenyl, 4-chlorophenyl, 4-bromophenyl, etc.), 2-halogenatednaphthalen-1-yl (for example, 2-fluoronaphthalen-1-yl, 2-chloronaphthalen-1-yl, 2-bromonaphthalen-1-yl, etc.), 3-halogenatednaphthalen-1-yl (for example, 3-fluoronaphthalen-1-yl, 3-chloronaphthalen-1-yl, 3-bromonaphthalen-1-yl, etc.), 4-halogenatednaphthalen-1-yl (for example, 4-fluoronaphthalen-1-yl, 4-chloronaphthalen-1-yl, 4-bromonaphthalen-1-yl, etc.), 5-halogenatednaphthalen-1-yl (for example, 5-fluoronaphthalen-1-yl, 5-chloronaphthalen-1-yl, 5-bromonaphthalen-1-yl, 5-bromonaphthalen-1-yl, etc.), 6-halogenatednaphthalen-1-yl (for example, 6-fluoronaphthalen-1-yl, 6-chloronaphthalen-1-yl, 6-bromonaphthalen-1-yl, etc.), 7-halogenatednaphthalen-1-yl (for example, 7-fluoronaphthalen-1-yl, 7-chloronaphthalen-1-yl, 7-bromonaphthalen-1-yl, etc.), 8-halogenatednaphthalen-1-yl (for example, 8-fluoronaphthalen-1-yl, 8-chloronaphthalen-1-yl, 8-bromonaphthalen-1-yl, etc.), 1-halogenatednaphthalen-2-yl (for example, 1-fluoronaphthalen-2-yl, 1-chloronaphthalen-2-yl, 1-bromonaphthalen-2-yl, etc.), 3-halogenatednaphthalen-2-yl (for example, 3-fluoronaphthalen-2-yl, 3-chloronaphthalen-2-yl, 3-bromonaphthalen-2-yl, etc.), 4-halogenatednaphthalen-2-yl (for example, 4-fluoronaphthalen-2-yl, 4-chloronaphthalen-2-yl, 4-bromonaphthalen-2-yl, etc.), 5-halogenatednaphthalen-2-yl (for example, 5-fluoronaphthalen-2-yl, 5-chloronaphthalen-2-yl, 5-bromonaphthalen-2-yl, etc.), 6-halogenatednaphthalen-2-yl (for example, 6-fluoronaphthalen-2-yl, 6-chloronaphthalen-2-yl, 6-bromonaphthalen-2-yl, etc.), 7-halogenatednaphthalen-2-yl (for example, 7-fluoronaphthalen-2-yl, 7-chloronaphthalen-2-yl, 7-bromonaphthalen-2-yl, etc.), 8-halogenatednaphthalen-2-yl (for example, 8-fluoronaphthalen-2-yl, 8-chloronaphthalen-2-yl, 8-bromonaphthalen-2-yl, etc.), 2-halogenated inden-1-yl (for example, 2-fluoroinden-1-yl, 2-chloroinden-1-yl, 2-bromoinden-1-yl, etc.), 3-halogenated inden-1-yl (for example, 3-fluoroinden-1-yl, 3-chloroinden-1-yl, 3-bromoinden-1-yl, etc.), 4-halogenated inden-1-yl (for example, 4-fluoroinden-1-yl, 4-chloroinden-1-yl, 4-bromoinden-1-yl, etc.), 5-halogenated inden-1-yl (for example, 5-fluoroinden-1-yl, 5-chloroinden-1-yl, 5-bromoinden-1-yl, etc.), 6-halogenated inden-1-yl (for example, 6-fluoroinden-1-yl, 6-chloroinden-1-yl, 6-bromoinden-1-yl, etc.), 7-halogenated inden-1-yl (for example, 7-fluoroinden-1-yl, 7-chloroinden-1-yl, 7-bromoinden-1-yl, etc.), 1-halogenated inden-2-yl (for example, 1-fluoroinden-2-yl, 1-chloroinden-2-yl, 1-bromoinden-2-yl, etc.), 3-halogenated inden-2-yl (for example, 3-fluoroinden-2-yl, 3-chloroinden-2-yl, 3-bromoinden-2-yl, etc.), 4-halogenated inden-2-yl (for example, 4-fluoroinden-2-yl, 4-chloroinden-2-yl, 4-bromoinden-2-yl, etc.), 5-halogenated inden-2-yl (for example, 5-fluoroinden-2-yl, 5-chloroinden-2-yl, 5-bromoinden-2-yl, etc.), 6-halogenated inden-2-yl (for example, 6-fluoroinden-2-yl, 6-chloroinden-2-yl, 6-bromoinden-2-yl, etc.), 7-halogenated inden-2-yl (for example, 7-fluoroinden-2-yl, 7-chloroinden-2-yl, 7-bromoinden-2-yl, etc.), 7-halogenated inden-4-yl (for example, 7-fluoroinden-4-yl, 7-chloroinden-4-yl, 7-bromoinden-4-yl, etc.), 5-halogenated inden-3-yl (for example, 5-fluoroinden-3-yl, 5-chloroinden-3-yl, 5-bromoinden-3-yl, etc.), 3-halogenated inden-5-yl (for example, 3-fluoroinden-5-yl, 3-chloroinden-5-yl, 3-bromoinden-5-yl, etc.), 2-halogenated inden-6-yl (for example, 2-fluoroinden-6-yl, 2-chloroinden-6-yl, 2-bromoinden-6-yl, etc.), 4-halogenated inden-7-yl (for example, 4-fluoroinden-7-yl, 4-chloroinden-7-yl, 4-bromoinden-7-yl, etc.), 1-halogenated inden-4-yl (for example, 1-fluoroinden-4-yl, 1-chloroinden-4-yl, 1-bromoinden-4-yl, etc.), 2,3-dihalogenatedphenyl (for example, 2,3-difluorophenyl, 2,3-dichlorophenyl, 2,3-dibromophenyl, etc.), 2,3-dihalogenatednaphthalen-1-yl (for example, 2,3-difluoronaphthalen-1-yl, 2,3-dichloronaphthalen-1-yl, 2,3-dibromonaphthalen-1-yl, etc.), 2,4-dihalogenated phenyl (for example, 2,4-difluorophenyl, 2,4-dichlorophenyl, 2,4-dibromophenyl, etc.), 2,6-dihalogenatedphenyl (for example, 2,6-difluorophenyl, 2,6-dichlorophenyl, 2,6-dibromophenyl, etc.), 4,5-dihalogenatednaphthalen-1-yl (for example, 4,5-difluoronaphthalen-1-yl, 4,5-dichloronaphthalen-1-yl, 4,5-dibromonaphthalen-1-yl, etc.), 4,6-dihalogenatednaphthalen-1-yl (for example, 4,6-difluoronaphthalen-1-yl, 4,6-dichloronaphthalen-1-yl, 4,6-dibromonaphthalen-1-yl, etc.), 4,8-dihalogenatednaphthalen-1-yl (for example, 4,8-difluoronaphthalen-1-yl, 4,8-dichloronaphthalen-1-yl, 4,8-dibromonaphthalen-1-yl, etc.) As shown above, the position to be substituted is not limited so that the position may be 2-, 3-, or 4-position in the case of phenyl, whereas 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, or 8-position in the case of naphthalen-1-yl.
- [0021] Examples of "lower alkyl" include a straight or branched chain alkyl group having 1 to 10 carbon atoms, such as methyl, ethyl, propyl, isopropyl, butyl, isobutyl, sec-butyl, tert-butyl, pentyl, isopentyl, neopentyl, tert-pentyl, 1-ethylpropyl, and hexyl.
- [0022] It should be noted that the term "lower" as herein used means that the number of carbon atoms of an aliphatic hydrocarbon group such as an alkyl or an alkenyl is 1-10, preferably 1-8, more preferably 1-6 unless otherwise indicated.
- [0023] Thus, examples of an aryl substituted with the lower alkyl include 2-methylphenyl, 3-methylphenyl, 4-methylphenyl, 2-ethylphenyl, 3-ethylphenyl, 4-ethylphenyl, 2-methylnaphthalen-1-yl, 3-methylnaphthalen-1-yl, 4-methylnaphthalen-1-yl, 5-methylnaphthalen-1-yl, 6-methylnaphthalen-1-yl, 7-methylnaphthalen-1-yl, 8-methylnaphthalen-

1-yl, 2,4-dimethylphenyl, 2,4,6-trimethylphenyl, 4,5-dimethylnaphthalen-1-yl, 4,6-dimethylnaphthalen-1-yl, 4,8-dimethylnaphthalen-1-yl, 2-methylinden-1-yl, 3-methylinden-1-yl, 4-methylinden-1-yl, 5-methylinden-1-yl, 6-methylinden-1-yl, 7-methylinden-1-yl, 1-methylinden-2-yl, 3-methylinden-2-yl, 4-methylinden-2-yl, 5-methylinden-2-yl, 6-methylinden-2-yl, 7-methylinden-2-yl, 1-methylinden-3-yl, 2-methylinden-3-yl, 4-methylinden-3-yl, 5-methylinden-3-yl, 6-methylinden-3-yl, 7-methylinden-3-yl, 1-methylinden-4-yl, 2-methylinden-4-yl, 3-methylinden-4-yl, 5-methylinden-4-yl, 6-methylinden-4-yl, 7-methylinden-4-yl, 1-methylinden-5-yl, 2-methylinden-5-yl, 3-methylinden-5-yl, 4-methylinden-5-yl, 6-methylinden-5-yl, 7-methylinden-5-yl, 1-methylinden-6-yl, 2-methylinden-6-yl, 3-methylinden-6-yl, 4-methylinden-6-yl, 5-methylinden-6-yl, 7-methylinden-6-yl, 1-methylinden-7-yl, 2-methylinden-7-yl, 3-methylinden-7-yl, 4-methylinden-7-yl, 5-methylinden-7-yl, 6-methylinden-7-yl. The position to be substituted is not limited so that the position may be 2-, 3-, or 4-position in the case of phenyl, whereas 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, or 8-position in the case of naphthalen-1-yl.

[0024] Examples of "lower alkenyl" include a straight or branched chain alkenyl group having 1 to 10 carbon atoms, such as vinyl, allyl, isopropenyl, 1-propenyl, 2-methyl-1-propenyl, 1-but enyl, 2-but enyl, 3-but enyl, 2-ethyl-1-but enyl, 3-methyl-2-but enyl, 1-pentenyl, 2-pentenyl, 3-pentenyl, 4-pentenyl, 4-methyl-3-pentenyl, or the like.

[0025] Thus, examples of an aryl substituted with the lower alkenyl include, but are not limited to, 2-vinylphenyl, 3-vinylphenyl, 4-vinylphenyl, 2-allylphenyl, 3-allylphenyl, 4-allylphenyl, 2-vinylnaphthalen-1-yl, 3-vinylnaphthalen-1-yl, 4-vinylnaphthalen-1-yl, 5-vinylnaphthalen-1-yl, 6-vinylnaphthalen-1-yl, 7-vinylnaphthalen-1-yl, 8-vinylnaphthalen-1-yl, 2-vinylinden-1-yl, 3-vinylinden-1-yl, 4-vinylinden-1-yl, 5-vinylinden-1-yl, 6-vinylinden-1-yl, 7-vinylinden-1-yl, 1-vinylinden-2-yl, 3-vinylinden-2-yl, 4-vinylinden-2-yl, 5-vinylinden-2-yl, 6-vinylinden-2-yl, 7-vinylinden-2-yl, 1-vinylinden-3-yl, 2-vinylinden-3-yl, 4-vinylinden-3-yl, 5-vinylinden-3-yl, 6-vinylinden-3-yl, 7-vinylinden-3-yl, 1-vinylinden-4-yl, 2-vinylinden-4-yl, 3-vinylinden-4-yl, 5-vinylinden-4-yl, 6-vinylinden-4-yl, 7-vinylinden-4-yl, 1-vinylinden-5-yl, 2-vinylinden-5-yl, 3-vinylinden-5-yl, 4-vinylinden-5-yl, 6-vinylinden-5-yl, 7-vinylinden-5-yl, 1-vinylinden-6-yl, 2-vinylinden-6-yl, 3-vinylinden-6-yl, 4-vinylinden-6-yl, 5-vinylinden-6-yl, 7-vinylinden-6-yl, 1-vinylinden-7-yl, 2-vinylinden-7-yl, 3-vinylinden-7-yl, 4-vinylinden-7-yl, 5-vinylinden-7-yl, 6-vinylinden-7-yl, or the like.

[0026] Examples of "lower alkoxy" include an alkoxy group having 1 to 10 carbon atoms, such as methoxy, ethoxy, propoxy, isopropoxy, butoxy, isobutoxy, neobutoxy, t-butoxy, pentoxy, isopentoxy, or the like.

[0027] Thus, examples of an aryl substituted with the lower alkoxy include 2-methoxyphenyl, 3-methoxyphenyl, 4-methoxyphenyl, 2-ethoxyphenyl, 3-ethoxyphenyl, 4-ethoxyphenyl, 2-methoxynaphthalen-1-yl, 3-methoxynaphthalen-1-yl, 4-methoxynaphthalen-1-yl, 5-methoxynaphthalen-1-yl, 6-methoxynaphthalen-1-yl, 7-methoxynaphthalen-1-yl, 8-methoxynaphthalen-1-yl, 2,4,6-trimethoxyphenyl, 4,5-dimethoxyphenyl, 4,6-dimethoxyphenyl, 4,8-dimethoxyphenyl, 1-methoxyinden-2-yl, 1-methoxyinden-3-yl, 1-methoxyinden-4-yl, 1-methoxyinden-5-yl, 1-methoxyinden-6-yl, 1-methoxyinden-7-yl, 1,3-dimethoxyinden-2-yl, 1,2-dimethoxyinden-3-yl, 1,3-dimethoxyinden-4-yl, 2,3-dimethoxyinden-5-yl, 1,4-dimethoxyinden-6-yl, 1,4-dimethoxyinden-7-yl, or the like.

[0028] Examples of "halogenated lower alkyl" include a lower alkyl as shown above substituted with a halogen atom, such as fluoromethyl, chloromethyl, bromomethyl, 2-fluoroethyl, 2-chloroethyl, 2-bromoethyl, 1-fluoroethyl, 1-chloroethyl, 1-bromoethyl, trifluoromethyl, trichloromethyl, tribromomethyl, difluoromethyl, dichloromethyl, dibromomethyl, 1,2-difluoroethyl, 1,2-dichloroethyl, 1,2-dibromoethyl, 1,1-difluoroethyl, 1,1-dichloroethyl, 1,1-dibromoethyl, 2,2-difluoroethyl, 2,2-dichloroethyl, 2,2-dibromoethyl, or the like.

[0029] Thus, examples of an aryl substituted with the halogenated lower alkyl include an aryl substituted with a halomethyl (for example, a phenyl substituted with fluoromethyl, naphthalen-1-yl substituted with fluoromethyl, a phenyl substituted with chloromethyl, naphthalen-1-yl substituted with chloromethyl, a phenyl substituted with bromomethyl, naphthalen-1-yl substituted with bromomethyl, etc.), an aryl substituted with a 2-haloethyl (for example, a phenyl substituted with 2-fluoroethyl, naphthalen-1-yl substituted with 2-fluoroethyl, a phenyl substituted with 2-chloroethyl, naphthalen-1-yl substituted with 2-chloroethyl, a phenyl substituted with 2-bromoethyl, naphthalen-1-yl substituted with 2-bromoethyl, etc.), an aryl substituted with a 1-haloethyl (for example, a phenyl substituted with 1-fluoroethyl, naphthalen-1-yl substituted with 1-fluoroethyl, a phenyl substituted with 1-bromoethyl, naphthalen-1-yl substituted with 1-bromoethyl, etc.), and an aryl substituted with a trihalomethyl (for example, a phenyl substituted with trifluoromethyl, naphthalen-1-yl substituted with trifluoromethyl, a phenyl substituted with trichloromethyl, naphthalen-1-yl substituted with trichloromethyl, a phenyl substituted with tribromomethyl, naphthalen-1-yl substituted with tribromomethyl, etc.). The position to be substituted is not limited so that the position may be 2-, 3-, or 4-position in the case of phenyl, whereas 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, or 8-position in the case of naphthalen-1-yl. In the case of indenyl, examples include, but are not limited to, 1-fluoromethylinden-2-yl, 1-chloromethylinden-2-yl, 1-bromomethylinden-2-yl, 1-(2-fluoroethyl)inden-2-yl, 1-(2-chloroethyl)inden-2-yl, 1-(2-bromoethyl)inden-2-yl, 1-(1-fluoroethyl)inden-2-yl, 1-(1-chloroethyl)inden-2-yl, 1-(1-bromoethyl)inden-2-yl, 1-trifluoromethylinden-2-yl, 1-trichloromethylinden-2-yl, 1-tribromomethylinden-2-yl, 1-fluoromethylinden-3-yl, 1-chloromethylinden-3-yl, 1-bromomethylinden-3-yl, 1-(2-fluoroethyl)inden-3-yl, 1-(2-chloroethyl)inden-3-yl, 1-(2-bromoethyl)inden-3-yl, 1-(1-fluoroethyl)inden-3-yl, 1-(1-chloroethyl)inden-3-yl, 1-(1-bromoethyl)inden-3-yl, 1-trifluoromethylinden-3-yl, 1-trichloromethylinden-3-yl, 1-tribromomethylinden-3-yl, 1-fluoromethylinden-4-yl, 1-chloromethylinden-4-yl,

5      1-bromomethylinden-4-yl, 1-(2-fluoroethyl)inden-4-yl, 1-(2-chloroethyl)inden-4-yl, 1-(2-bromoethyl)inden-4-yl, 1-(1-fluoroethyl)inden-4-yl, 1-(1-chloroethyl)inden-4-yl, 1-(1-bromoethyl)inden-4-yl, 1-trifluoromethylinden-4-yl, 1-trichloromethylinden-4-yl, 1-tribromomethylinden-4-yl, 1-fluoromethylinden-5-yl, 1-chloromethylinden-5-yl, 1-bromomethylinden-5-yl, 1-(2-fluoroethyl)inden-5-yl, 1-(2-chloroethyl)inden-5-yl, 1-(2-bromoethyl)inden-5-yl, 1-(1-fluoroethyl)inden-5-yl, 1-(1-chloroethyl)inden-5-yl, 1-(1-bromoethyl)inden-5-yl, 1-trifluoromethylinden-5-yl, 1-trichloromethylinden-5-yl, 1-tribromomethylinden-5-yl, 1-fluoromethylinden-6-yl, 1-chloromethylinden-6-yl, 1-bromomethylinden-6-yl, 1-(2-fluoroethyl)inden-6-yl, 1-(2-chloroethyl)inden-6-yl, 1-(2-bromoethyl)inden-6-yl, 1-(1-fluoroethyl)inden-6-yl, 1-(1-chloroethyl)inden-6-yl, 1-(1-bromoethyl)inden-6-yl, 1-trifluoromethylinden-6-yl, 1-trichloromethylinden-6-yl, 1-tribromomethylinden-6-yl, 1-fluoromethylinden-7-yl, 1-chloromethylinden-7-yl, 1-bromomethylinden-7-yl, 1-(2-fluoroethyl)inden-7-yl, 1-(2-chloroethyl)inden-7-yl, 1-(2-bromoethyl)inden-7-yl, 1-(1-fluoroethyl)inden-7-yl, 1-(1-chloroethyl)inden-7-yl, 1-(1-bromoethyl)inden-7-yl, 1-trifluoromethylinden-7-yl, 1-trichloromethylinden-7-yl, 1-tribromomethylinden-7-yl, or the like.

10     [0030] Examples of "halogenated lower alkenyl" include a lower alkenyl as shown above substituted with a halogen atom such as 3-fluoro-1-propenyl, 3-chloro-1-propenyl, 3-bromo-1-propenyl, 4-fluoro-2-but enyl, 4-chloro-2-but enyl, 4-bromo-2-but enyl, 1-fluoro-2-but enyl, 1-chloro-2-but enyl, 1-bromo-2-but enyl, or the like.

15     [0031] Thus, examples of an aryl substituted with the halogenated lower alkenyl include an aryl substituted with a 3-halo-1-propenyl (for example, a phenyl substituted with 3-fluoro-1-propenyl, naphthalen-1-yl substituted with 3-fluoro-1-propenyl, a phenyl substituted with 3-chloro-1-propenyl, naphthalen-1-yl substituted with 3-chloro-1-propenyl, a phenyl substituted with 3-bromo-1-propenyl, naphthalen-1-yl substituted with 3-bromo-1-propenyl, etc.), an aryl substituted with a 4-halo-2-but enyl (for example, a phenyl substituted with 4-fluoro-2-but enyl, naphthalen-1-yl substituted with 4-fluoro-2-but enyl, a phenyl substituted with 4-chloro-2-but enyl, naphthalen-1-yl substituted with 4-chloro-2-but enyl, a phenyl substituted with 4-bromo-2-but enyl, naphthalen-1-yl substituted with 4-bromo-2-but enyl, etc.), an aryl substituted with a 1-halo-2-but enyl (for example, a phenyl substituted with 1-fluoro-2-but enyl, naphthalen-1-yl substituted with 1-fluoro-2-but enyl, a phenyl substituted with 1-chloro-2-but enyl, naphthalen-1-yl substituted with 1-chloro-2-but enyl, a phenyl substituted with 1-bromo-2-but enyl, naphthalen-1-yl substituted with 1-bromo-2-but enyl, etc.), or the like. The position to be substituted is not limited so that the position may be 2-, 3-, or 4-position in the case of phenyl, whereas 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, or 8-position in the case of naphthalen-1-yl. In the case of Indenyl, examples include, but are not limited to, 1-(3-fluoro-1-propenyl)inden-2-yl, 1-(3-chloro-1-propenyl)inden-2-yl, 1-(3-bromo-1-propenyl)inden-2-yl, 1-(4-fluoro-2-but enyl)inden-2-yl, 1-(4-chloro-2-but enyl)inden-2-yl, 1-(4-bromo-2-but enyl)inden-2-yl, 1-(1-fluoro-2-but enyl)inden-2-yl, 1-(1-chloro-2-but enyl)inden-2-yl, 1-(1-bromo-2-but enyl)inden-2-yl, 1-(3-fluoro-1-propenyl)inden-3-yl, 1-(3-chloro-1-propenyl)inden-3-yl, 1-(3-bromo-1-propenyl)inden-3-yl, 1-(4-fluoro-2-but enyl)inden-3-yl, 1-(4-chloro-2-but enyl)inden-3-yl, 1-(4-bromo-2-but enyl)inden-3-yl, 1-(1-fluoro-2-but enyl)inden-3-yl, 1-(1-chloro-2-but enyl)inden-3-yl, 1-(1-bromo-2-but enyl)inden-3-yl, 1-(3-fluoro-1-propenyl)inden-4-yl, 1-(3-chloro-1-propenyl)inden-4-yl, 1-(3-bromo-1-propenyl)inden-4-yl, 1-(4-fluoro-2-but enyl)inden-4-yl, 1-(4-chloro-2-but enyl)inden-4-yl, 1-(4-bromo-2-but enyl)inden-4-yl, 1-(1-fluoro-2-but enyl)inden-4-yl, 1-(1-chloro-2-but enyl)inden-4-yl, 1-(1-bromo-2-but enyl)inden-4-yl, 1-(3-fluoro-1-propenyl)inden-5-yl, 1-(3-chloro-1-propenyl)inden-5-yl, 1-(3-bromo-1-propenyl)inden-5-yl, 1-(4-fluoro-2-but enyl)inden-5-yl, 1-(4-chloro-2-but enyl)inden-5-yl, 1-(4-bromo-2-but enyl)inden-5-yl, 1-(1-fluoro-2-but enyl)inden-5-yl, 1-(1-chloro-2-but enyl)inden-5-yl, 1-(1-bromo-2-but enyl)inden-5-yl, 1-(3-fluoro-1-propenyl)inden-6-yl, 1-(3-chloro-1-propenyl)inden-6-yl, 1-(3-bromo-1-propenyl)inden-6-yl, 1-(4-fluoro-2-but enyl)inden-6-yl, 1-(4-chloro-2-but enyl)inden-6-yl, 1-(4-bromo-2-but enyl)inden-6-yl, 1-(1-fluoro-2-but enyl)inden-6-yl, 1-(1-chloro-2-but enyl)inden-6-yl, 1-(1-bromo-2-but enyl)inden-6-yl, 1-(3-fluoro-1-propenyl)inden-7-yl, 1-(3-chloro-1-propenyl)inden-7-yl, 1-(3-bromo-1-propenyl)inden-7-yl, 1-(4-fluoro-2-but enyl)inden-7-yl, 1-(4-chloro-2-but enyl)inden-7-yl, 1-(4-bromo-2-but enyl)inden-7-yl, 1-(1-fluoro-2-but enyl)inden-7-yl, 1-(1-chloro-2-but enyl)inden-7-yl, 1-(1-bromo-2-but enyl)inden-7-yl, or the like.

20     [0032] Examples of "a halogenated lower alkoxy" include a lower alkoxy as shown above substituted with a halogen atom such as fluoromethoxy, chloromethoxy, bromomethoxy, 1-fluoroethoxy, 1-chloroethoxy, 1-bromoethoxy, 2-fluoroethoxy, 2-chloroethoxy, 2-bromoethoxy, or the like.

25     [0033] Thus, examples of an aryl substituted with the halogenated lower alkoxy include an aryl substituted with a halo-methoxy (for example, a phenyl substituted with fluoromethoxy, naphthalen-1-yl substituted with fluoromethoxy, a phenyl substituted with chloromethoxy, naphthalen-1-yl substituted with chloromethoxy, a phenyl substituted with bromomethoxy, naphthalen-1-yl substituted with bromomethoxy, etc.), an aryl substituted with a halo-ethoxy (for example, a phenyl substituted with 1-fluoroethoxy, naphthalen-1-yl substituted with 1-fluoroethoxy, a phenyl substituted with 1-chloroethoxy, naphthalen-1-yl substituted with 1-chloroethoxy, a phenyl substituted with 1-bromoethoxy, naphthalen-1-yl substituted with 1-bromoethoxy, a phenyl substituted with 2-fluoroethoxy, naphthalen-1-yl substituted with 2-fluoroethoxy, a phenyl substituted with 2-chloroethoxy, naphthalen-1-yl substituted with 2-chloroethoxy, a phenyl substituted with 2-bromoethoxy, naphthalen-1-yl substituted with 2-bromoethoxy, etc.). The position to be substituted is not limited so that the position may be 2-, 3-, or 4-position in the case of phenyl, whereas 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, or 8-position in the case of naphthalen-1-yl. In the case of indenyl, examples include, but are not limited to, 1-fluorometh-

- oxyinden-2-yl, 1-chloromethoxyinden-2-yl, 1-bromomethoxyinden-2-yl, 1-(1-fluoroethoxy)inden-2-yl, 1-(1-chloroethoxy)inden-2-yl, 1-(1-bromoethoxy)inden-2-yl, 1-(2-fluoroethoxy)inden-2-yl, 1-(2-chloroethoxy)inden-2-yl, 1-(1-fluoroethoxy)inden-3-yl, 1-chloromethoxyinden-3-yl, 1-bromomethoxyinden-3-yl, 1-(1-chloroethoxy)inden-3-yl, 1-(1-bromoethoxy)inden-3-yl, 1-(2-fluoroethoxy)inden-3-yl, 1-(2-chloroethoxy)inden-3-yl, 1-(2-bromoethoxy)inden-3-yl, 1-(1-fluoromethoxyinden-4-yl, 1-chloromethoxyinden-4-yl, 1-bromomethoxyinden-4-yl, 1-(1-fluoroethoxy)inden-4-yl, 1-(1-chloroethoxy)inden-4-yl, 1-(1-bromoethoxy)inden-4-yl, 1-(2-fluoroethoxy)inden-4-yl, 1-(2-chloroethoxy)inden-4-yl, 1-(1-fluoromethoxyinden-5-yl, 1-chloromethoxyinden-5-yl, 1-(1-fluoroethoxy)inden-5-yl, 1-(1-chloroethoxy)inden-5-yl, 1-(1-bromoethoxy)inden-5-yl, 1-(2-fluoroethoxy)inden-5-yl, 1-(2-chloroethoxy)inden-5-yl, 1-(2-bromoethoxy)inden-5-yl,
- 10 1-(1-fluoromethoxyinden-6-yl, 1-chloromethoxyinden-6-yl, 1-bromomethoxyinden-6-yl, 1-(1-fluoroethoxy)inden-6-yl, 1-(1-chloroethoxy)inden-6-yl, 1-(1-bromoethoxy)inden-6-yl, 1-(2-fluoroethoxy)inden-6-yl, 1-(2-chloroethoxy)inden-6-yl, 1-(1-fluoromethoxyinden-7-yl, 1-chloromethoxyinden-7-yl, 1-bromomethoxyinden-7-yl, 1-(1-fluoroethoxy)inden-7-yl, 1-(1-chloroethoxy)inden-7-yl, 1-(1-bromoethoxy)inden-7-yl, 1-(2-fluoroethoxy)inden-7-yl, 1-(2-chloroethoxy)inden-7-yl.
- 15 [0034] Examples of an aryl substituted with hydroxy as shown above include 2-hydroxyphenyl, 2-hydroxynaphthalen-1-yl, 3-hydroxyphenyl, 3-hydroxynaphthalen-1-yl, 4-hydroxyphenyl, 4-hydroxynaphthalen-1-yl, 5-hydroxynaphthalen-1-yl, 6-hydroxynaphthalen-1-yl, 7-hydroxynaphthalen-1-yl, 8-hydroxynaphthalen-1-yl, 1-hydroxyinden-1-yl, 1-hydroxyinden-2-yl, 1-hydroxyinden-3-yl, 1-hydroxyinden-4-yl, 1-hydroxyinden-5-yl, 1-hydroxyinden-6-yl, 1-hydroxyinden-7-yl, 1-hydroxyinden-8-yl, 1-(1-chloroethoxy)inden-3-yl, 1-(1-bromoethoxy)inden-3-yl, 1-(2-fluoroethoxy)inden-3-yl, 1-(2-chloroethoxy)inden-3-yl, 1-(1-bromoethoxy)inden-4-yl, 1-(2-fluoroethoxy)inden-4-yl, 1-(2-chloroethoxy)inden-4-yl, 1-(1-bromoethoxy)inden-5-yl, 1-(2-fluoroethoxy)inden-5-yl, 1-(2-chloroethoxy)inden-5-yl, 1-(1-bromoethoxy)inden-6-yl, 1-(2-fluoroethoxy)inden-6-yl, 1-(2-chloroethoxy)inden-6-yl, 1-(1-bromoethoxy)inden-7-yl, 1-(2-fluoroethoxy)inden-7-yl, 1-(2-chloroethoxy)inden-7-yl.
- 20 [0035] The term "an acyl" as shown above has the same meaning as "an acyl" as a substituent in "an aliphatic hydrocarbon group which may be optionally substituted" as described hereinafter.
- [0036] Examples of an aryl substituted with an acyl include, but are not limited to, 2-acetylphenyl, 2-acetylnaphthalen-1-yl, 3-acetylphenyl, 3-acetylnaphthalen-1-yl, 4-acetylphenyl, 4-acetylnaphthalen-1-yl, 5-acetylnaphthalen-1-yl, 6-acetylnaphthalen-1-yl, 7-acetylnaphthalen-1-yl, 8-acetylnaphthalen-1-yl, 1-acetylinden-1-yl, 1-acetylinden-2-yl, 1-acetylinden-3-yl, 1-acetylinden-4-yl, 1-acetylinden-5-yl, 1-acetylinden-6-yl, 1-acetylinden-7-yl, 1-acetylinden-8-yl, 3-acetylinden-2-yl, 4-acetylinden-2-yl, 5-acetylinden-2-yl, 6-acetylinden-2-yl, 7-acetylinden-2-yl, 1-acetylinden-3-yl, 2-acetylinden-3-yl, 4-acetylinden-3-yl, 5-acetylinden-3-yl, 6-acetylinden-3-yl, 7-acetylinden-3-yl, 1-acetylinden-4-yl, 2-acetylinden-4-yl, 3-acetylinden-4-yl, 5-acetylinden-4-yl, 6-acetylinden-4-yl, 7-acetylinden-4-yl, or the like.
- 30 [0037] Examples of an aryl substituted with an amino include 2-aminophenyl, 2-aminonaphthalen-1-yl, 3-aminophenyl, 3-aminonaphthalen-1-yl, 4-aminophenyl, 4-aminonaphthalen-1-yl, 5-aminonaphthalen-1-yl, 6-aminonaphthalen-1-yl, 7-aminonaphthalen-1-yl, 8-aminonaphthalen-1-yl, or the like.
- [0038] A in G<sup>1</sup> is preferably an oxygen atom.
- [0039] "halogen atom" represented by R<sup>1</sup>-R<sup>6</sup> in G<sup>1</sup> has the same meaning as shown above.
- 35 [0040] Aliphatic hydrocarbon group in "an aliphatic hydrocarbon group which may be optionally substituted" represented by R<sup>1</sup>-R<sup>6</sup> in G<sup>1</sup> means a straight or branched chain aliphatic hydrocarbon group (an alkyl, an alkenyl, an alkynyl, etc.).
- [0041] Examples of an alkyl in the "aliphatic hydrocarbon group" include a straight or branched chain alkyl having 1 to 20 carbon atoms, such as methyl, ethyl, propyl, isopropyl, butyl, isobutyl, sec-butyl, tert-butyl, pentyl, isopentyl, neopentyl, tert-pentyl, 1-ethylpropyl, hexyl, isohexyl, heptyl, octyl, decyl, tetrahydrogeranyl, dodecyl, tridecyl, tetrade- cyl, hexadecyl, octadecyl, nonadecyl, eicosanyl, or the like. Preferred groups are an alkyl having 1 to 10 carbon atoms.
- 40 [0042] Examples of an alkenyl in the "aliphatic hydrocarbon group" include a straight or branched chain alkenyl having 2 to 20 carbon atoms, such as vinyl, allyl, isopropenyl, 1-propenyl, 2-methyl-1-propenyl, 1-but enyl, 2-but enyl, 3-but enyl, 2-ethyl-1-but enyl, 3-methyl-2-but enyl, 1-pentenyl, 2-pentenyl, 3-pentenyl, 4-pentenyl, 4-methyl-3-pentenyl, 1-hexenyl, 2-hexenyl, 3-hexenyl, 4-hexenyl, 5-hexenyl, 1-heptenyl, 1-octenyl, geranyl, 1-decenyl, 1-tetradecenyl, 1-octadecenyl, 9-octadecenyl, 1-eicosenyl, 3,7,11,15-tetramethyl-1-hexadecenyl, or the like. Preferred groups are an alkenyl having 2 to 8 carbon atoms.
- 45 [0043] Examples of an alkynyl in the "aliphatic hydrocarbon group" include a alkynyl having 2 to 20 carbon atoms which may contain a double bond, such as ethynyl, 1-propynyl, 2-propynyl, 2-penten-4-ynyl, or the like. Preferred groups are an alkynyl having 2 to 8 carbon atoms.
- 50 [0044] The term "(aliphatic hydrocarbon group which may be optionally substituted)-O-" represented by R<sup>1</sup>-R<sup>6</sup> in G<sup>1</sup> means a group wherein an aliphatic hydrocarbon group as defined above is bound to an oxygen atom, and include an alkoxy, an alkenyloxy, an alkynyoxy, or the like.
- 55 [0045] Preferred examples of substituents of "an aliphatic hydrocarbon group which may be optionally substituted" specifically include a halogen atom, hydroxy, a lower alkoxy, lower alkenyloxy, lower alkylcarbonyloxy, a carboxyl, a substituted or unsubstituted carbamoyl, a cyano, a substituted or unsubstituted amino, an amidino, an azido, a nitro, a nitroso, mercapto, a (lower alkyl)thio, a sulfo, a substituted or unsubstituted, saturated or unsaturated alicyclic hydrocarbon group, a substituted or unsubstituted, monocyclic or fused polycyclic aryl, a substituted or unsubstituted

heterocyclic group, an acyl, or the like. The number of substituents of "an aliphatic hydrocarbon group which may be optionally substituted" is 1 to 5, and preferably 1 to 3. The position of the substituents is not limited.

[0046] "Halogen" as a substituent on "an aliphatic hydrocarbon group which may be optionally substituted" has the same meaning as shown above. "Lower alkoxy" as a substituent on "an aliphatic hydrocarbon group which may be optionally substituted" has the same meaning as shown above.

5 [0047] Examples of "lower alkenyloxy" as a substituent on "an aliphatic hydrocarbon group which may be optionally substituted" include a alkenyloxy having 2 to 7 carbon atoms, such as vinyloxy, allyloxy, 1-propenyloxy, 2-methyl-1-propenyloxy, 1-butenyloxy, 2-butenyloxy, 3-butenyloxy, 2-ethyl-1-butenyloxy, 3-methyl-2-butenyloxy, 1-pentenyloxy, 2-pentenyloxy, 3-pentenyloxy, 4-pentenyloxy, 4-methyl-3-pentenyloxy, or the like.

10 [0048] Examples of "lower alkylcarbonyloxy" as a substituent on "an aliphatic hydrocarbon group which may be optionally substituted" include an alkylcarbonyloxy having 2 to 7 carbon atoms, such as methylcarbonyloxy, ethylcarbonyloxy, propylcarbonyloxy, isopropylcarbonyloxy, butylcarbonyloxy, isobutylcarbonyloxy, t-butylcarbonyloxy, pentylcarbonyloxy, isopentylcarbonyloxy, neopentylcarbonyloxy, t-pentylcarbonyloxy, hexylcarbonyloxy, or the like.

15 [0049] Examples of "substituted carbamoyl" as a substituent on "an aliphatic hydrocarbon group which may be optionally substituted" include N-mono-(a lower alkyl)carbamoyl, N,N-di-(a lower alkyl)carbamoyl, N-hydroxycarbamoyl, N-(lower alkoxy)carbamoyl, N-hydroxy-N-(a lower alkyl)carbamoyl, N-(a lower alkoxy)-N-(a lower alkyl)carbamoyl, N-phenylcarbamoyl, N-(substituted phenyl)carbamoyl, or the like.

20 [0050] Examples of the "N-mono-(a lower alkyl)carbamoyl" include N-methylcarbamoyl, N-ethylcarbamoyl, N-propylcarbamoyl, N-isopropylcarbamoyl, N-pentylcarbamoyl, N-isopentylcarbamoyl, N-neopentylcarbamoyl, N-t-pentylcarbamoyl, N-1-ethylpropylcarbamoyl, N-hexylcarbamoyl, or the like, since the lower alkyl has the same meaning as shown above.

25 [0051] Examples of the "N,N-di-(a lower alkyl)carbamoyl" include N,N-dimethylcarbamoyl, N-ethyl-N-methylcarbamoyl, N,N-diethylcarbamoyl, N-methyl-N-propylcarbamoyl, N-butyl-N-methylcarbamoyl, N-butyl-N-ethylcarbamoyl, N-butyl-N-propylcarbamoyl, N-butyl-N-isopropylcarbamoyl, N,N-dibutylcarbamoyl, N-ethyl-N-propylcarbamoyl, N,N-dipropylcarbamoyl, N-isopropyl-N-n-propylcarbamoyl, N-isopropyl-N-methylcarbamoyl, or the like, since the lower alkyl has the same meaning as shown above.

30 [0052] Examples of the "N-hydroxy-N-(a lower alkyl)carbamoyl" include a N-hydroxy-N-(a lower alkyl)carbamoyl having 2 to 7 carbon atoms, such as N-hydroxy-N-methylcarbamoyl, N-hydroxy-N-ethylcarbamoyl, N-hydroxy-N-propylcarbamoyl, N-hydroxy-N-butylcarbamoyl, N-hydroxy-N-isopropylcarbamoyl, N-hydroxy-N-isobutylcarbamoyl, N-hydroxy-N-sec-butylcarbamoyl, N-hydroxy-N-t-butylcarbamoyl, N-hydroxy-N-pentylcarbamoyl, N-hydroxy-N-isopentylcarbamoyl, N-hydroxy-N-neopentylcarbamoyl or the like, since the lower alkyl has the same meaning as shown above.

35 [0053] Examples of "N-(a lower alkoxy)-N-(a lower alkyl)carbamoyl" include a N-(a lower alkoxy)-N-(a lower alkyl)carbamoyl having 3 to 13 carbon atoms as the whole number of carbon atoms, such as N-methoxy-N-methylcarbamoyl, N-methoxy-N-ethylcarbamoyl, N-methoxy-N-propylcarbamoyl, N-methoxy-N-butylcarbamoyl, N-methoxy-N-isopropylcarbamoyl, N-methoxy-N-isobutylcarbamoyl, N-methoxy-N-sec-butylcarbamoyl, N-methoxy-N-t-butylcarbamoyl, N-methoxy-N-pentylcarbamoyl, N-methoxy-N-isopentylcarbamoyl, N-methoxy-N-neopentylcarbamoyl or the like, since the lower alkyl has the same meaning as shown above.

40 [0054] Examples of the substituents of the "N-(a substituted phenyl)carbamoyl" include a lower alkyl, a lower alkoxy, hydroxy, or the like, each of which has the same meaning as shown above. Preferred examples of the "N-(a substituted phenyl)carbamoyl" include (4-methylphenyl)carbamoyl, (4-ethylphenyl)carbamoyl, (4-hydroxyphenyl)carbamoyl, (4-methoxyphenyl)carbamoyl, (2,3-dihydroxyphenyl)carbamoyl, (2,3-methoxyphenyl)carbamoyl, (2,4-dihydroxyphenyl)carbamoyl, (2,4-methoxyphenyl)carbamoyl, (2,6-dihydroxyphenyl)carbamoyl, (2,6-methoxyphenyl)carbamoyl, (2,4,6-trihydroxyphenyl)carbamoyl, (2,4,6-trimethoxyphenyl)carbamoyl, (2,4-dimethoxy-6-hydroxyphenyl)carbamoyl, (2,6-dimethoxy-4-hydroxyphenyl)carbamoyl, (4,6-dihydroxy-2-methoxyphenyl)carbamoyl, (2,4-dimethoxyphenyl)carbamoyl, (2,3,4-trimethoxyphenyl)carbamoyl, (2,3-dimethoxy-4-hydroxyphenyl)carbamoyl, (2,4-dimethoxy-3-hydroxyphenyl)carbamoyl, (2,3-dihydroxy-4-methoxyphenyl)carbamoyl, (3,4-dimethoxy-2-hydroxyphenyl)carbamoyl, (2,4-dihydroxy-3-methoxyphenyl)carbamoyl, (2,4-dimethoxy-6-methylphenyl)carbamoyl, (2,6-dimethoxy-4-methylphenyl)carbamoyl, or the like.

45 [0055] Examples of "substituted amino" as a substituent in the definitions of R<sup>1</sup>-R<sup>6</sup>, and "an aliphatic hydrocarbon group which may be optionally substituted" include mono-(a lower alkyl)amino, a di-(a lower alkyl)amino, (a lower alkyl)carbonyl amino, or the like.

50 [0056] Examples of the "mono-(a lower alkyl)amino" include a mono-(a lower alkyl)amino in which the number of carbon atoms of the alkyl is 1 to 6, such as methylamino, ethylamino, propylamino, isopropylamino, butylamino, isobutylamino, sec-butylamino, t-butylamino, pentylamino, isopentylamino, hexylamino, or the like, since the lower alkyl has the same meaning as shown above.

55 [0057] Examples of the "di-(a lower alkyl)amino" include a di-(a lower alkyl)amino in which the whole number of the carbon is 2 to 20, such as dimethylamino, ethylmethylamino, diethylamino, methylpropylamino, ethylpropylamino, isopropylmethylamino, isopropylethylamino, butylmethylamino, isobutylmethylamino, isobutylethylamino,

no, or the like, since the lower alkyl has the same meaning as shown above.

[0058] Examples of the "(a lower alkyl)carbonyl amino" include an alkylcarbonyl amino having 2 to 7 carbon atoms, such as methylcarbonylamino, ethylcarbonylamino, propylcarbonylamino, isopropylcarbonylamino, butylcarbonylamino, isobutylcarbonylamino, sec-butylcarbonylamino, t-butylcarbonylamino, pentylcarbonylamino, isopentylcarbonylamino, or the like, since the lower alkyl has the same meaning as shown above.

5 [0059] Examples of "(a lower alkyl)thio" as a substituent on "an aliphatic hydrocarbon group which may be optionally substituted" include a (lower alkyl)thio having 1 to 6 carbon atoms, such as methylthio, ethylthio, propylthio, isopropylthio, butylthio, isobutylthio, neobutylthio, t-butylthio, pentylthio, hexylthio, or the like, since the lower alkyl has the same meaning as shown above.

10 [0060] "A substituted or unsubstituted, saturated or unsaturated alicyclic hydrocarbon group" as a substituent on "an aliphatic hydrocarbon group which may be optionally substituted" is exemplified by a cycloalkyl, a cycloalkenyl, a cycloalkadienyl, or the like, and has a similar meaning to those in "a cyclic group which may be optionally substituted" represented by Ar<sup>1</sup> and Ar<sup>2</sup>.

15 [0061] "A substituted or unsubstituted, monocyclic or fused polycyclic aryl" as a substituent on "an aliphatic hydrocarbon group which may be optionally substituted" has a similar meaning to those in "a cyclic group which may be optionally substituted" represented by Ar<sup>1</sup> and Ar<sup>2</sup>.

[0062] A heterocyclic group of "a substituted or unsubstituted heterocyclic group" as a substituent on "an aliphatic hydrocarbon group which may be optionally substituted" has a similar meaning to those in "a cyclic group which may be optionally substituted" represented by Ar<sup>1</sup> and Ar<sup>2</sup>.

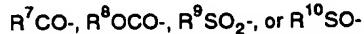
20 [0063] Preferred examples of the substituents of "a substituted, saturated or unsaturated alicyclic hydrocarbon group", "a substituted, monocyclic or fused polycyclic aryl", and "a substituted heterocyclic group" as shown above include halogen, hydroxy, a lower alkyl, a substituted lower alkyl (wherein the substituent is a halogen, hydroxy, a lower alkoxy or (a lower alkyl)carbonyl), a lower alkenyl, a lower alkynyl, a lower alkoxy, a lower alkenyloxy, a lower alkylcarbonyloxy, a carboxyl, a lower alkylcarbonyl, (a lower alkoxy)carbonyl, a carbamoyl, a lower alkylcarbamoyl, N-di(a lower alkyl)carbamoyl, N-hydroxycarbamoyl, N-hydroxyN-(a lower alkyl)carbamoyl, N-(a phenyl)carbamoyl, N-(a substituted phenyl)carbamoyl, a cyano, an amino, mono-(a lower alkyl)amino, di-(a lower alkyl)amino, (a lower alkyl)carbonylamino, an amidino, an azido, a nitro, a nitroso, mercapto, (a lower alkyl)thio, a sulfo, a saturated or unsaturated, alicyclic hydrocarbon group, a monocyclic or fused polycyclic aryl, a heterocyclic group, or the like. The number of the substituent(s) is 1 to 3, and preferably 1. The position of the substituent(s) is not limited.

30 [0064] Preferred examples of "(a lower alkyl)carbonyl" as shown above include an alkanoyl having 2 to 6 carbon atoms, such as acetyl, propionyl, butylyl, isobutylyl, valeryl, isovaleryl, pivaloyl, hexanoyl, or the like, since the lower alkyl has the same meaning as shown above.

[0065] Preferred examples of "(a lower alkoxy)carbonyl" include an alkoxy carbonyl having 2 to 7 carbon atoms, such as methoxycarbonyl, ethoxycarbonyl, n-propoxycarbonyl, n-butoxycarbonyl, since the lower alkoxy has the same meaning as shown above.

35 [0066] The substituents other than those described above have a similar meaning to those mentioned in the substituents of "an aliphatic hydrocarbon group which may be optionally substituted".

[0067] "An acyl" as a substituent in the definitions of R<sup>1</sup>-R<sup>6</sup> and in "an aliphatic hydrocarbon group which may be optionally substituted" means an acyl derived from a carboxylic acid which may be optionally substituted, an oxycarboxylic acid which may be optionally substituted, a sulfonic acid which may be optionally substituted, a sulfenic acid which may be optionally substituted, or the like. Specific examples include a group of the formula:



45 in which R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup> and R<sup>10</sup> are each a hydrocarbon group which may be optionally substituted or a heterocyclic group which may be optionally substituted.

[0068] Examples of "a hydrocarbon group" in "a hydrocarbon group or heterocyclic group which may be optionally substituted" represented by R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup> and R<sup>10</sup> include a straight or branched chain aliphatic hydrocarbon group (an alkyl, an alkenyl, an alkynyl, etc.) or the like as a non-cyclic group, and include a saturated or unsaturated, alicyclic hydrocarbon group (a cycloalkyl, a cycloalkenyl, a cycloalkadienyl, etc.), a monocyclic or fused polycyclic aryl, or the like as a cyclic group. The meanings and specific examples of them are as shown above.

50 [0069] Examples of the substituents of "an amino group which may be optionally substituted" represented by R<sup>1</sup>-R<sup>6</sup> in G<sup>1</sup> include hydroxy, a lower alkyl, a substituted lower alkyl (wherein the substituent is a halogen, hydroxy, a lower alkoxy or (a lower alkyl)carbonyl), a lower alkenyl, a lower alkynyl, a lower alkoxy, a lower alkenyloxy, a lower alkylcarbonyloxy, a carboxyl, a lower alkylcarbonyl, (a lower alkoxy)carbonyl, a carbamoyl, a lower alkylcarbamoyl, N-di(a lower alkyl)carbamoyl, N-hydroxycarbamoyl, N-hydroxy-N-(a lower alkyl)carbamoyl, N-(a phenyl)carbamoyl, N-(a substituted phenyl)carbamoyl, a saturated or unsaturated, alicyclic hydrocarbon group, an monocyclic or fused polycyclic aryl, a het-

erocyclic group, or the like. The meanings of them are as shown above.

- [0070] Examples of the substituents of "a sulfo group which may be optionally substituted" represented by R<sup>1</sup>-R<sup>6</sup> in G<sup>1</sup> include hydroxy, a lower alkyl, a substituted lower alkyl (wherein the substituent is a halogen, hydroxy, a lower alkoxy or (a lower alkyl)carbonyl), a lower alkenyl, a lower alkynyl, a lower alkoxy, a lower alkenyloxy, a lower alkylcarbonyloxy, a carbonyl, a lower alkylcarbonyl, lower alkoxy carbonyl, a carbamoyl, a lower alkylcarbamoyl, N-di(a lower alkyl)carbamoyl, N-hydroxycarbamoyl, N-hydroxy-N-(a lower alkyl)carbamoyl, N-(a phenyl)carbamoyl, N-(a substituted phenyl)carbamoyl, a cyano, an amino, mono lower alkyl amino, di lower alkyl amino, lower alkylcarbonyl amino, a nitro, a saturated or unsaturated, alicyclic hydrocarbon group, an monocyclic or fused polycyclic aryl, a heterocyclic group, or the like. The meanings of them are as shown above.
- [0071] The meaning of an aryl of "an aryl which may be optionally substituted" represented by R<sup>1</sup>-R<sup>6</sup> in G<sup>1</sup> is as shown above.
- [0072] Examples of the substituents of "an aryl which may be optionally substituted" represented by R<sup>1</sup>-R<sup>6</sup> in G<sup>1</sup> include a similar substituent to those in "a substituted, saturated or unsaturated alicyclic hydrocarbon group", "a substituted, monocyclic or fused polycyclic aryl", "a substituted heterocyclic group" as shown above. The meanings of them are as shown above.
- [0073] Examples of the substituents of "a methylene which may be optionally substituted" that is formed by the combination of R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> and R<sup>4</sup> or R<sup>5</sup> and R<sup>6</sup> in G<sup>1</sup> include a halogen, hydroxy, a lower alkoxy, a lower alkenyloxy, (a lower alkyl)carbonyloxy, a carboxyl, a substituted or unsubstituted carbamoyl, a cyano, a substituted or unsubstituted amino, an amidino, an azido, a nitro, a nitroso, mercapto, (a lower alkyl)thio, a sulfo, an acyl, or the like. The meanings of them are as shown above.
- [0074] Examples of the substituents of "an imino which may be optionally substituted" that is formed by the combination of R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> and R<sup>4</sup> or R<sup>5</sup> and R<sup>6</sup> in G<sup>1</sup> include halogen, hydroxy, a lower alkoxy, a lower alkenyloxy, (a lower alkyl)carbonyloxy, a carboxyl, a substituted or unsubstituted carbamoyl, mercapto, (a lower alkyl)thio, a sulfo, an acyl, or the like. The meanings of them are as shown above.
- [0075] Preferably, R<sup>1</sup>-R<sup>6</sup> in G<sup>1</sup> are the same or different, and are a hydrogen atom, or a lower alkyl.
- [0076] G<sup>1</sup> is Preferably -O- or -O-CR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>.
- [0077] "An azacyclic group which may be optionally substituted (hereinafter the group is conveniently abbreviated as "G<sup>2</sup>") of the formula:

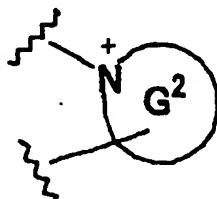
30

35

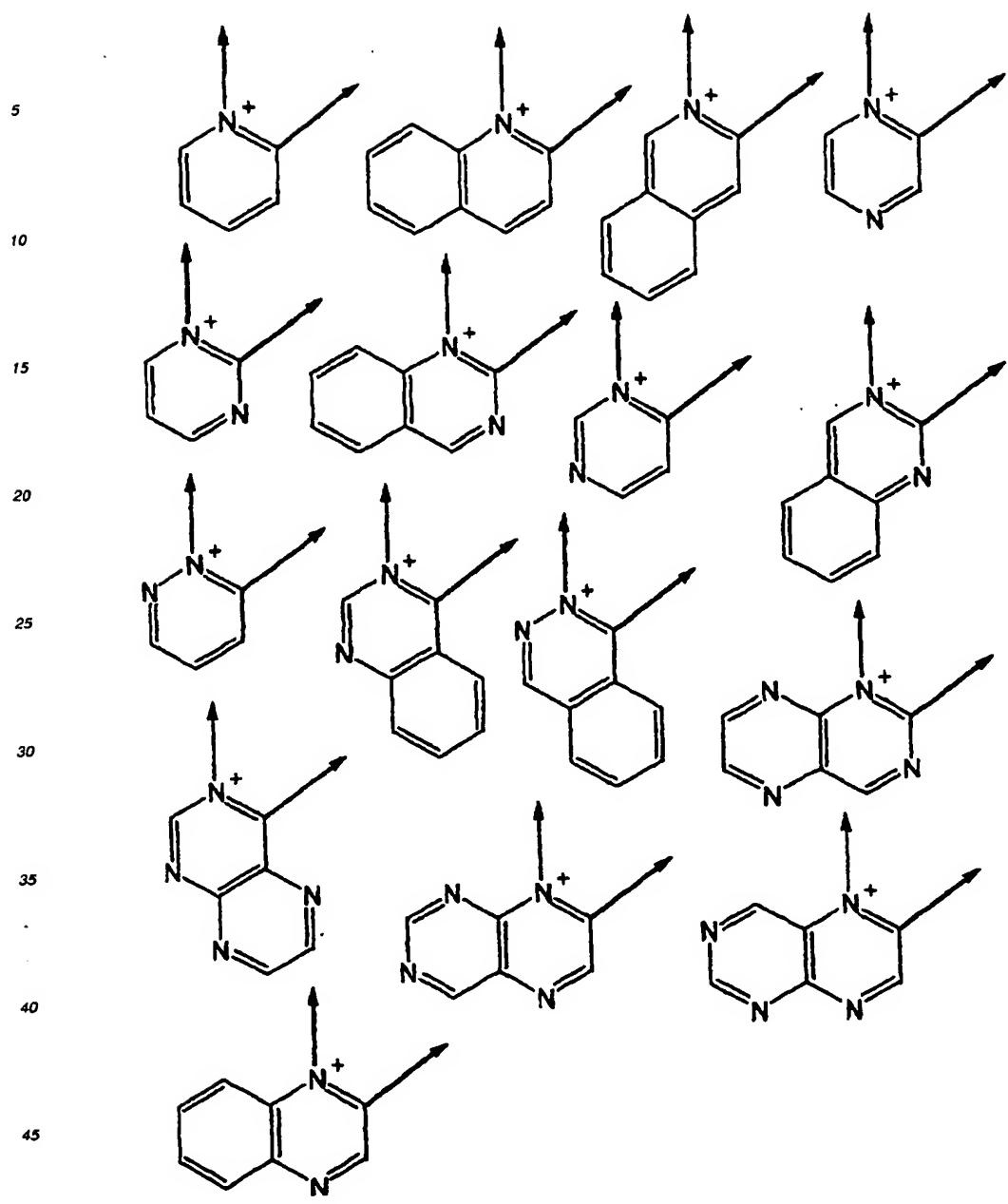
40

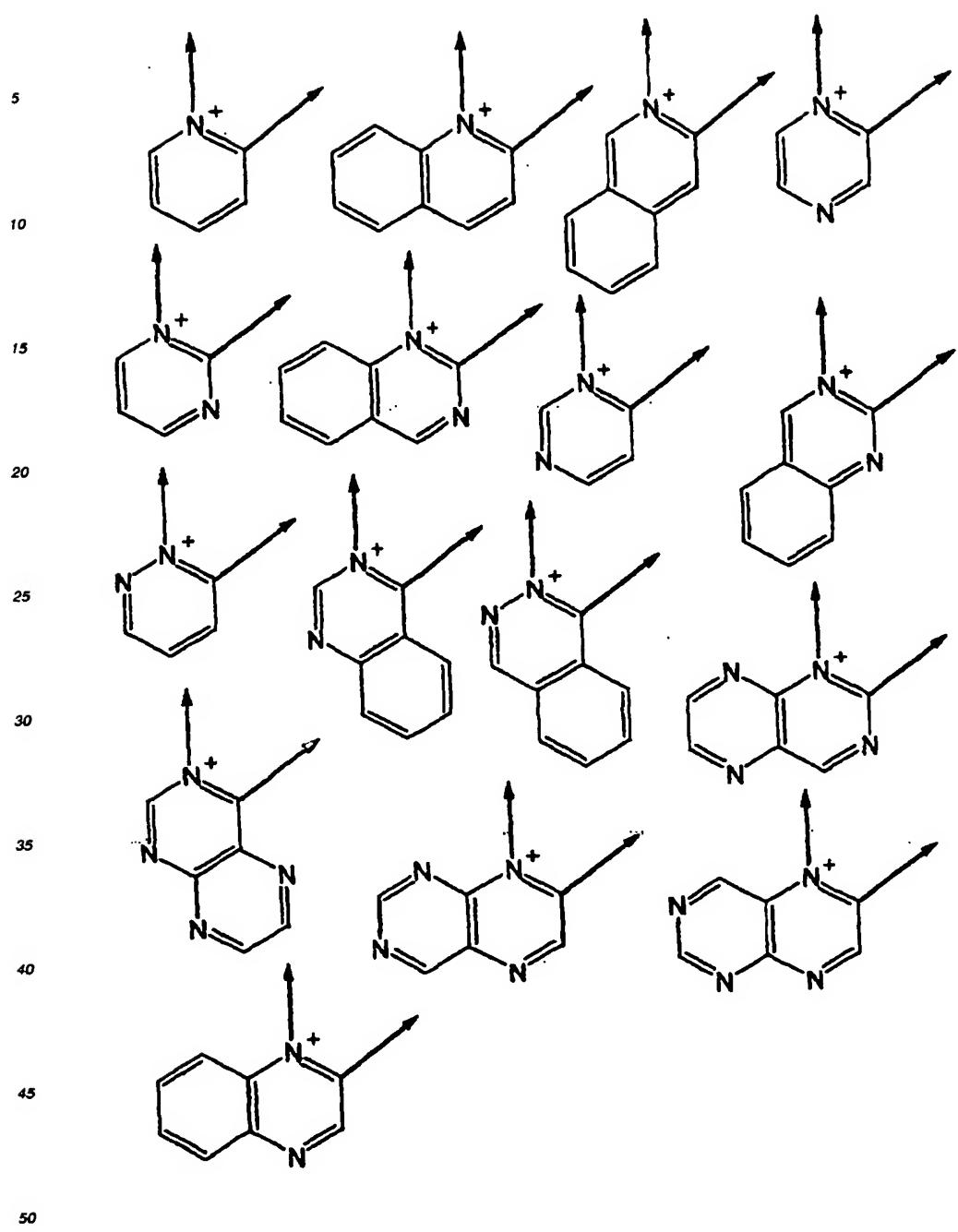
50

55

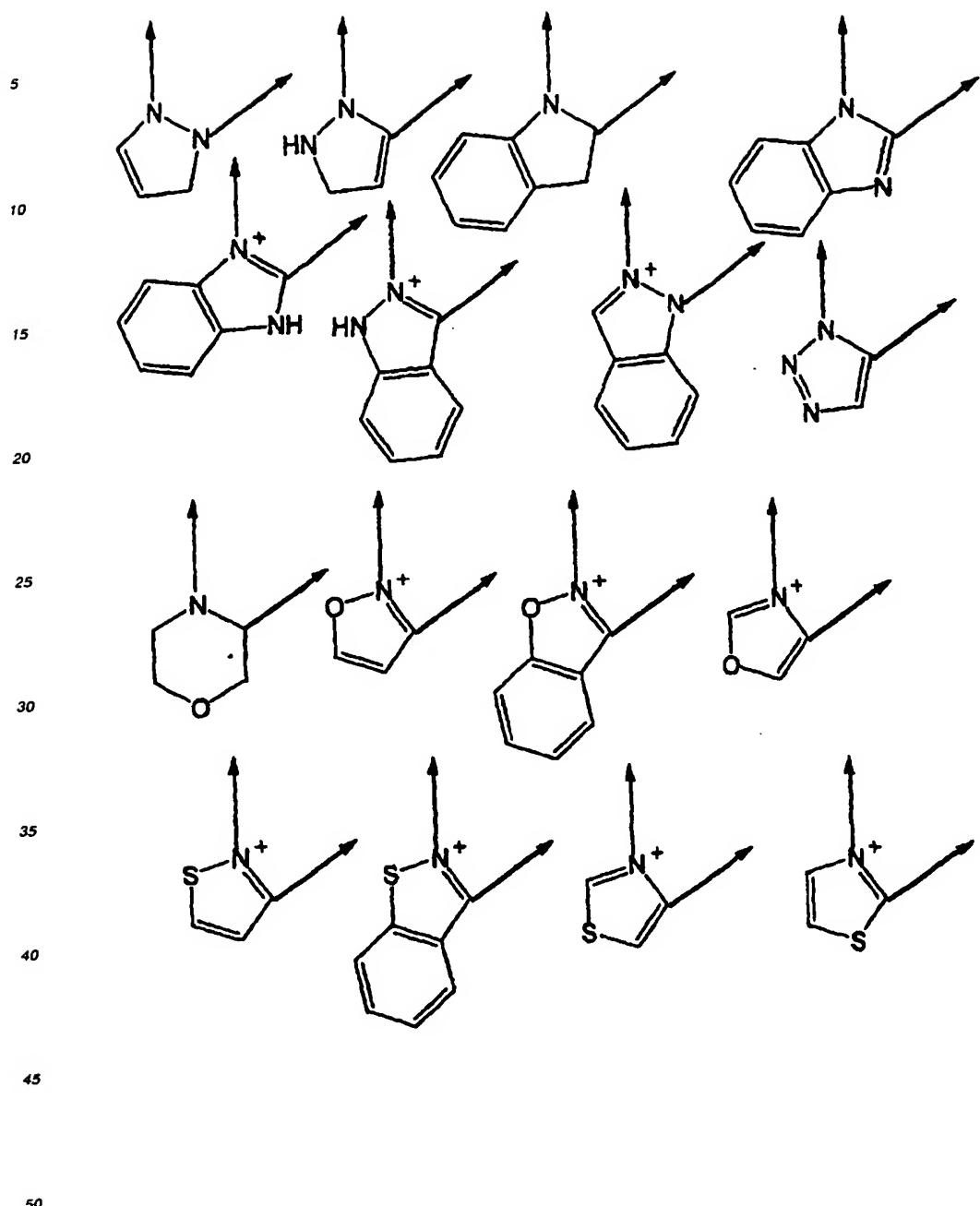


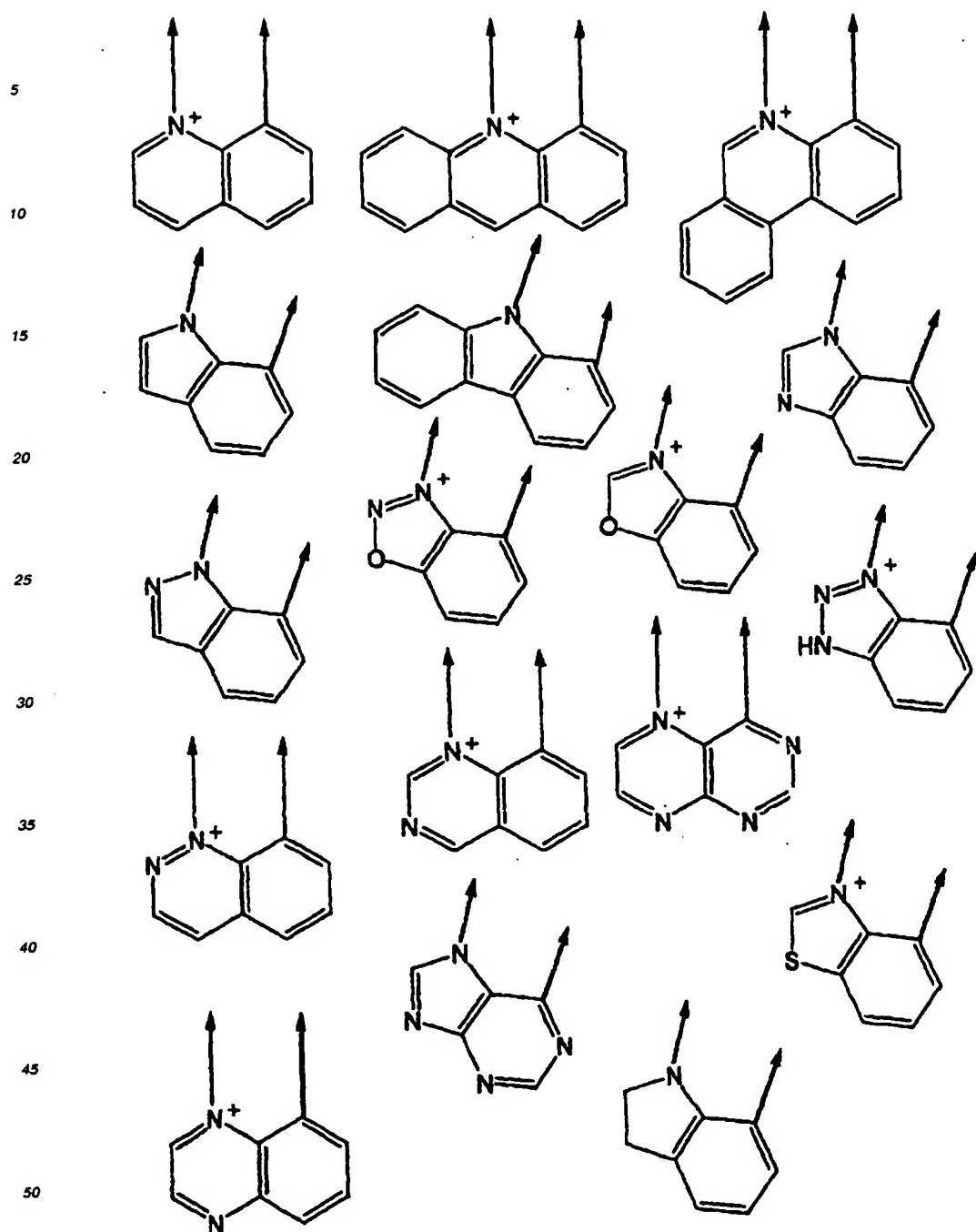
may be either a monocyclic or fused cyclic group. Examples of the cyclic groups are listed below. In the following formulae, even though the endocyclic nitrogen atom bound to the boron is not associated with a symbol +, the nitrogen atom is acquiring a plus ion charge on substitution by hydrogen or an aliphatic hydrocarbon group which may be optionally substituted (preferably, a lower alkyl (for example, methyl, etc.)).



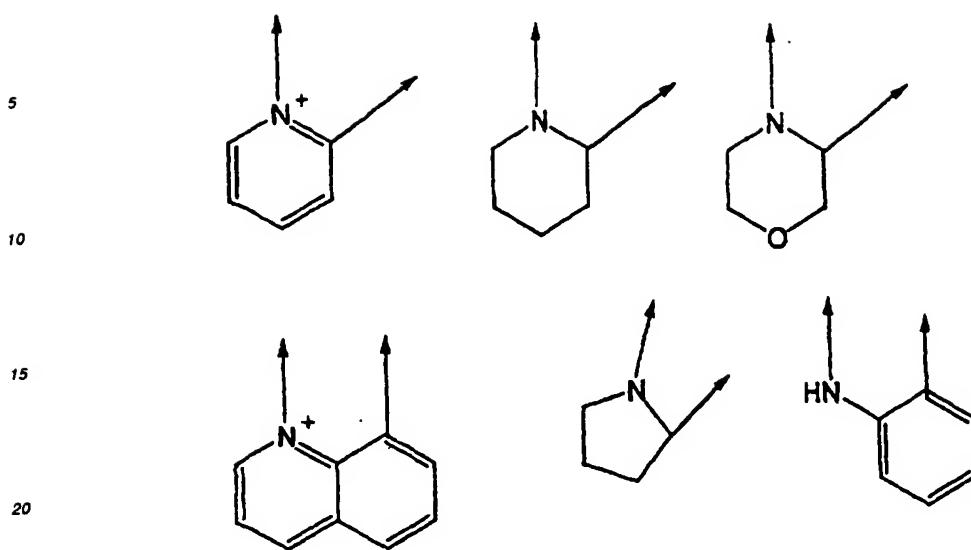


55





[0078] More preferred examples of the cyclic groups as described above include the following ones.



25 [0079] The phrase "provided that the smallest ring among rings constructed with  $\text{B}^\circ$ ,  $\text{G}^1$  and  $\text{G}^2$  is a 5- or 6-membered ring" in the definitions of formula (I) means that the smallest membered ring among those which contains  $\text{B}^\circ$ ,  $\text{G}^1$  that is a chain group, and the nitrogen atom bound to the boron in the group:  $\text{G}^2$  in the definition of formula (I), is a 5- or 6-membered ring.

30 [0080] A pharmaceutical composition useful for animals except for humans, which comprises a compound of formula (I) wherein  $\text{Ar}^1$  and  $\text{Ar}^2$  are the same, and are an aryl which may be optionally substituted, or a salt thereof or a hydrate of them, is preferred, and a pharmaceutical composition useful for animals except for humans, which comprises a compound of formula (I) wherein both  $\text{Ar}^1$  and  $\text{Ar}^2$  are an aryl which may be optionally substituted,  $\text{G}^1$  is a group of the formula:  $-\text{O}-$ ,  $-\text{O}-\text{CR}^1\text{R}^2-$  or  $-\text{O}-\text{CR}^3\text{R}^4-\text{CR}^5\text{R}^6-$  wherein  $\text{R}^1-\text{R}^6$  are the same or different, and are each a hydrogen atom, a halogen atom, hydroxy, a lower alkyl which may be optionally substituted, a lower alkenyl which may be optionally substituted, a lower alkyloxy which may be optionally substituted, or a lower alkenyloxy which may be optionally substituted; or a salt thereof or a hydrate of them is more preferred.

35 [0081] In the formula (II), "an aryl which may be optionally substituted" represented by  $\text{Ar}^{\text{a}1}$  has the same meaning as shown above except that naphthalen-2-yl is substituted at the 1-position by naphthalen-1-yl, in this context.

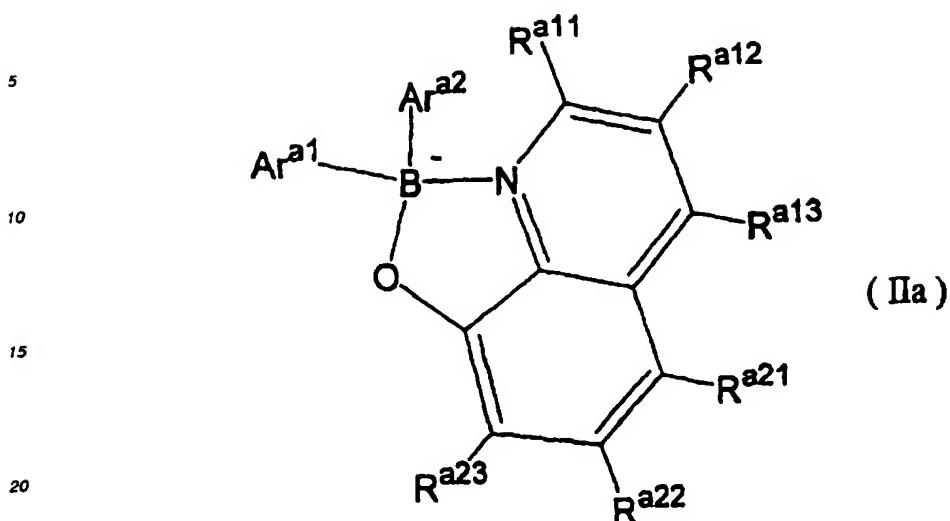
40 [0082] Examples of a fused aryl which may be optionally substituted (provided that when the fused aryl is naphthalen-2-yl, then naphthalen-2-yl is not substituted at the 1-position by naphthalen-1-yl) represented by  $\text{Ar}^{\text{a}2}$ , include indenyl (1-indenyl, 2-indenyl, 3-indenyl, 4-indenyl, 5-indenyl, 6-indenyl, 7-indenyl), naphthyl (1-naphthyl, 2-naphthyl, etc.), an-thryl, phenanthryl, acenaphthylenyl, fluorenyl (9-fluorenyl, 1-fluorenyl, etc.), or the like.

45 [0083] Examples of the substituents on the fused aryl which may be optionally substituted include halogen, hydroxy, a lower alkyl, a substituted lower alkyl (wherein the substituent is a halogen, hydroxy, a lower alkoxy, or (a lower alkyl) carbonyl), a lower alkenyl, a lower alkynyl, a lower alkoxy, a lower alkenyloxy, (a lower alkyl)carboalkoxy, a carboxyl, (a lower alkyl)carbonyl, (a lower alkoxy)carbonyl, a carbamoyl, (a lower alkyl)carbamoyl, N-di-(a lower alkyl)carbamoyl, N-hydroxycarbamoyl, N-hydroxy-N-(a lower alkyl)carbamoyl, N-(a phenyl)carbamoyl, N-(a substituted phenyl)carbamoyl, a cyano, an amino, a mono-(a lower alkyl)amino, a di-(a lower alkyl)amino, (a lower alkyl)carbonylamino, an amidino, an azido, a nitro, a nitroso, a mercapto, (a lower alkyl)thio, a sulfo, a saturated or unsaturated alicyclic hydrocarbon group, a monocyclic or fused polycyclic aryl, a heterocyclic group, or the like. The number of the substituent is 1 to 3, and preferably 1. The position of the substituent is not limited.

50 [0084] Examples of a preferable substituent among them include a halogen atom, methyl, tri-halomethyl, hydroxy, methoxy, an amino group, or a sulfo group. More preferable substituents include fluorine, chlorine, bromine, methyl, trifluoromethyl, trichloromethyl, hydroxy, methoxy, or a sulfo group.

55 [0085] The definitions of  $\text{R}^{\text{a}1}$  and  $\text{R}^{\text{a}2}$  are as shown above.

[0086] Among the compounds of formula (II), preferred compounds are shown by formula (IIa):

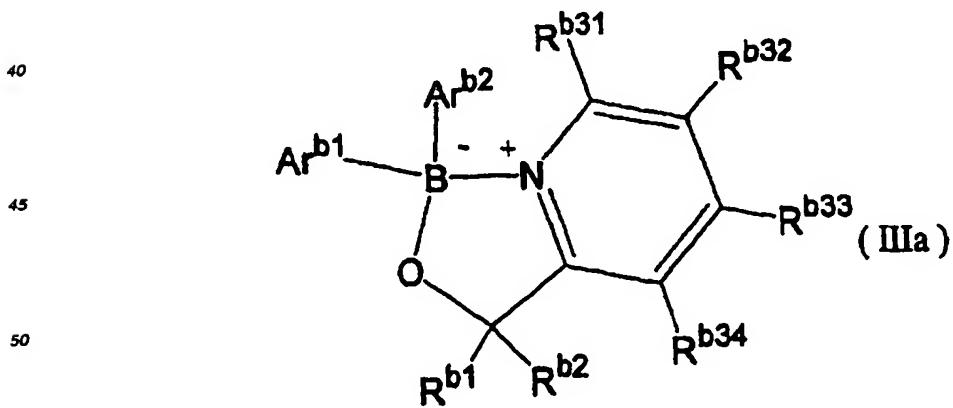


in which

25 both  $\text{Ar}^{\text{a}1}$  and  $\text{Ar}^{\text{a}2}$  are an aryl which may be optionally substituted;  
 each of  $\text{R}^{\text{a}11}\text{-}\text{R}^{\text{a}13}$  and  $\text{R}^{\text{a}21}\text{-}\text{R}^{\text{a}23}$  are the same or different, and are independently a hydrogen atom, a halogen atom, a lower alkyl, a lower alkenyl, a lower haloalkyl, hydroxy, an amino group which may be optionally substituted, or a sulfo group which may be optionally substituted. More preferably, each of  $\text{R}^{\text{a}11}\text{-}\text{R}^{\text{a}13}$  and  $\text{R}^{\text{a}21}\text{-}\text{R}^{\text{a}23}$  are the same or different, and are each a hydrogen atom, a halogen atom, methyl, trihalomethyl, hydroxy, methoxy, an amino group, or a sulfo group. Even more preferably,  $\text{R}^{\text{a}11}$ ,  $\text{R}^{\text{a}21}$ , and  $\text{R}^{\text{a}23}$  are the same or different, and are fluorine, chlorine, bromine, methyl, trifluoromethyl, trichloromethyl, hydroxy, methoxy, or a sulfo group.

30

35 [0087] In formula (III), the definitions of  $\text{Ar}^{\text{b}1}$ ,  $\text{Ar}^{\text{b}2}$ ,  $\text{R}^{\text{b}1}$ ,  $\text{R}^{\text{b}2}$ , and  $\text{R}^{\text{b}3}$  are as shown above.  
 [0088] Among the compounds of formula (III), preferred compounds are shown by formula (IIIa):



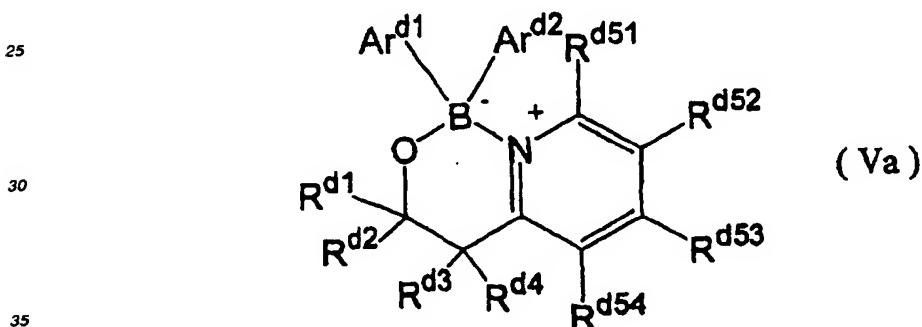
55 In which

both  $\text{Ar}^{\text{b}1}$  and  $\text{Ar}^{\text{b}2}$  are an aryl which may be optionally substituted;  
 $\text{R}^{\text{b}1}$  and  $\text{R}^{\text{b}2}$  are independently a hydrogen atom, a halogen atom, a lower alkyl, a lower alkenyl, a halogenated

lower alkyl, a halogenated lower alkenyl, an aralkyl which may be optionally substituted, hydroxy, a lower alkoxy, a lower alkenyloxy, a halogenated lower alkoxy, a halogenated lower alkenyloxy, an acyloxy, phenoxy which may be optionally substituted, an aralkyloxy which may be optionally substituted, an amino group which may be optionally substituted, a sulfo group which may be optionally substituted, or an aryl which may be optionally substituted, or R<sup>b1</sup> and R<sup>b2</sup> are combined together to form oxo, a methylene which may be optionally substituted, or an imino which may be optionally substituted;

R<sup>b31</sup>-R<sup>b34</sup> are the same or different, and are each a hydrogen atom, a halogen atom, a lower alkyl, a lower alkenyl, a lower haloalkyl, hydroxy, an amino group which may be optionally substituted or a sulfo group which may be optionally substituted. More preferably, R<sup>b31</sup>-R<sup>b34</sup> are the same or different, and are each a hydrogen atom, a halogen atom, methyl, trihalomethyl, hydroxy, methoxy, an amino group, or a sulfo group. Even more preferably, R<sup>b32</sup>, R<sup>b33</sup>, and R<sup>b34</sup> are the same or different, and are fluorine, chlorine, bromine, methyl, trifluoromethyl, trichloromethyl, hydroxy, methoxy, or a sulfo group.

- [0089] The definitions of Ar<sup>c1</sup>, Ar<sup>c2</sup>, R<sup>c1</sup>, R<sup>c2</sup>, and R<sup>c3</sup> in formula (IV) are as shown above.
- [0090] Among the compounds of formula (IV), preferred compounds are those wherein Ar<sup>c1</sup> and Ar<sup>c2</sup> are an aryl which may be optionally substituted, R<sup>c3</sup> are independently a hydrogen atom, a halogen atom, a lower alkyl, a lower alkenyl, a lowerhalo alkyl, hydroxy, an amino group which may be optionally substituted, or a sulfo group which may be optionally substituted. More preferred compounds are those wherein R<sup>c3</sup> are independently fluorine, chlorine, bromine, methyl, trifluoromethyl, trichloromethyl, hydroxy, methoxy or a sulfo group.
- [0091] The definitions of Ar<sup>d1</sup>, Ar<sup>d2</sup>, R<sup>d1</sup>, R<sup>d2</sup>, R<sup>d3</sup>, R<sup>d4</sup>, and R<sup>d5</sup> in formula (V) are as shown above.
- [0092] Among the compounds of formula (V), preferred compounds are shown by formula (Va):



in which

- Ar<sup>d1</sup> and Ar<sup>d2</sup> are aryl which may be optionally substituted;
- R<sup>d1</sup>, R<sup>d2</sup>, R<sup>d3</sup> and R<sup>d4</sup> are independently a hydrogen atom, a halogen atom, a lower alkyl, a lower alkenyl, a halogenated lower alkyl, a halogenated lower alkenyl, an aralkyl which may be optionally substituted, hydroxy, a lower alkoxy, a lower alkenyloxy, a halogenated lower alkoxy, a halogenated lower alkenyloxy, an acyloxy, phenoxy which may be optionally substituted, an aralkyloxy which may be optionally substituted, an amino group which may be optionally substituted, a sulfo group which may be optionally substituted, or an aryl which may be optionally substituted, or R<sup>d1</sup> and R<sup>d2</sup> and/or R<sup>d3</sup> and R<sup>d4</sup> are combined together to form an oxo, a methylene which may be optionally substituted, or an imino which may be optionally substituted;
- Rd51-Rd54 are the same or different, and are each a hydrogen atom, a halogen atom, a lower alkyl, a lower alkenyl, a lower haloalkyl, hydroxy, an amino group which may be optionally substituted, or a sulfo group which may be optionally substituted. More preferred compounds are those wherein Rd51-Rd54 are the same or different, and are a hydrogen atom, a halogen atom, methyl, trihalomethyl, hydroxy, methoxy, an amino group, or a sulfo group. Even more preferred compounds are those wherein Rd52, Rd53, and Rd54 are the same or different, and are fluorine, chlorine, bromine, methyl, trifluoromethyl, trichloromethyl, hydroxy, methoxy or a sulfo group.
- [0093] The present invention also encompasses pharmaceutically acceptable salt and hydrates thereof.
- [0094] Preferred salts of the objective compounds of the invention are pharmaceutically acceptable salts, and examples of such salts include a salt formed with an inorganic base, a salt formed with an organic base, a salt formed with an inorganic acid, a salt formed with an organic acid, and a basic or acidic amino acid salt. Examples of the salt

- formed with an inorganic base include those formed with an alkali metal such as a sodium salt and a potassium salt, those formed with an alkali earth metal such as a calcium salt, a magnesium salt and a barium salt, as well as an aluminium salt, an ammonium salt, and the like. Examples of the salt formed with an organic base include those formed with trimethylamine, triethylamine, pyridine, picoline, ethanolamine, diethanolamine, triethanolamine, dicyclohexylamine, N,N'-dibenzylethylenediamine, and the like. Examples of the salt formed with an inorganic acid include those formed with hydrochloric acid, hydrofluoric acid, hydrobromic acid, nitric acid, sulfuric acid, phosphoric acid, perchloric acid, hydroiodic acid, and the like. Examples of the salt formed with an organic acid include those formed with formic acid, acetic acid, trifluoroacetic acid, fumaric acid, oxalic acid, tartaric acid, maleic acid, citric acid, succinic acid, malic acid, mandelic acid, ascorbic acid, lactic acid, gluconic acid, methanesulfonic acid, p-toluenesulfonic acid, benzenesulfonic acid, and the like. Examples of the salt formed with a basic amino acid include those formed with arginine, lysine, ornithine, and the like. Examples of the salt formed with an acidic amino acid include those formed with aspartic acid, glutaminic acid, and the like.
- [0095] Preferred "hydrates" of the objective compounds of the present invention and the salts thereof are pharmaceutically acceptable hydrates, and specifically, a monohydrate, a dihydrate, a hexahydrate and the like are exemplified.
- [0096] In another aspect, the present invention relates to a pharmaceutical composition useful for animals except for humans, a pharmaceutical composition for use as an antiprotozoal agent and a pharmaceutical composition for use as an anticoccidial agent, each of which comprises the compound of formula (I), (II), (III), (IV) or (V) as shown above or a salt thereof, or a hydrate of them.
- [0097] As used herein, "a pharmaceutical composition useful for animals except for humans" means a medicament used in diagnosis, treatment or prevention of any disease in animals except for humans, and uses of the pharmaceutical composition useful for animals of the invention include those as all animal drugs such as an anticoccidial agent, a growth promoting agent and the like. Examples of the animals to be subjected to the pharmaceutical composition useful for animals of the invention include poultry such as fowl, goose, pheasant, turkey, and ducks, and livestock such as cattle, rabbit, sheep, goat, and pig.
- [0098] The antiprotozoal agent means a medicament for prevention or treatment of the infections caused by protozoa including toxoplasma, malaria and Coccidia which is as follows.
- [0099] The anticoccidial agent means a medicament for prevention or treatment of the infection mostly caused by *Eimeria tenella*, *Eimeria acervulina* and *Eimeria necatrix* and the like.

### 30 BEST MODE FOR CARRYING OUT THE INVENTION

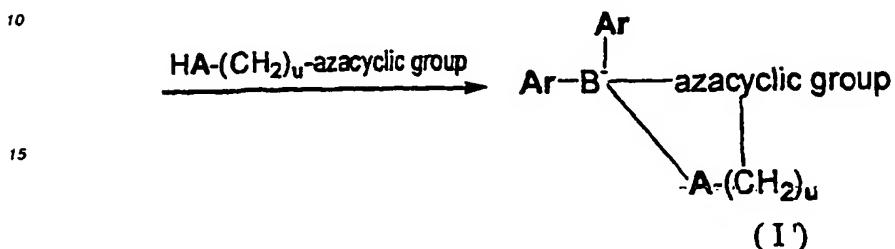
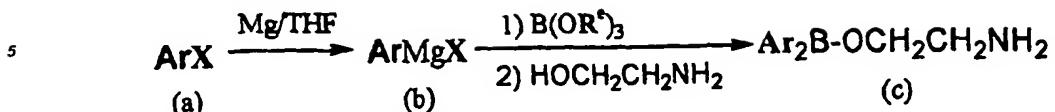
- [0100] Compounds (I) of the invention, i.e., the compounds represented by formula (I) (the compounds represented by the other formulae may be hereinafter referred to as in a similar manner) can be prepared, for example, via the synthetic pathway as shown below, making reference to known literature (e.g., Youji Huaxue (1989), 9(3), 226-9, Pharmazie (1985), 40(11), 767-71, Pharmazie (1985), 40(6), 387-93, Pharmazie (1985), 40(5), 307-11, J. Chem. Soc. Perkin Train. 2 (1992) 527-532, Journal of Organometallic Chemistry, 297(1985) 13-19).
- [0101] Some kinds of substituents (R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> and R<sup>4</sup>) in the compound (for example, hydroxy group, carbonyl group, amino group, and the like) may be reactive during a reaction in the following synthetic pathway, and then any protecting group may be appropriately used to protect such substituents and removed after the reaction so that the preparation is conducted.

45

50

55

## Reaction Scheme



20 wherein, u is an integer of 0, 1 or 2, R<sup>6</sup> is an alkyl group having 1 to 8 carbon atoms, and the other symbols are as defined above.

## Step 1

**[0102]** First at all, compounds of formula: ArMgX (b) are prepared by reacting compound (a) with magnesium in an ether solvent such as tetrahydrofuran (THF). In this reaction, compound (a) can be used in one equivalent or more, preferably 1.1 to 1.3 equivalents relative to magnesium. Examples of useful ether solvents include tetrahydrofuran, diethyl ether, dioxane, and the like. If necessary, a mixture of an ether solvent with an aromatic hydrocarbon (for example, toluene, benzene, xylene, etc.) or a saturated hydrocarbon (for example, cyclohexane, hexane, etc.) may be used. Reaction temperature is -20 to 150 °C, and preferably 0 to 50 °C. The reaction may be conducted for 5 to 10 hours although the reaction time will vary depending on the compound to be reacted. Usually, the reaction product can be obtained in a clear solution or in a form of slurry.

35 Step 2

[0103] Compounds of formula (c) are prepared by reacting compound (b) as obtained above in a solution or in a form of slurry with borate compound  $(B(OR^*)_3)$ , and then with ethanolamine ( $HOCH_2CH_2NH_2$ ) in an appropriate solvent.

**[0104]** In the reaction, the borate ester can be used in 0.5 equivalents or less, preferably 0.5 to C.4 equivalents relative to compound (b) obtained in Step 1. In the subsequent reaction, ethanolamine can be used in 0.5 equivalents or more, preferably 0.5 to 0.7 equivalents relative to compound (b). If necessary in these reactions, ethers, aromatic hydrocarbons, saturated hydrocarbons as described in Step 1 may be used as a solvent. The reaction between compound (b) and a borate ester may be conducted at a temperature of -90 to 100 °C, preferably -30 to 40 °C, and may be kept for 0.5 to 10 hours, although the reaction time will vary depending on the compound to be reacted. The subsequent reaction with ethanolamine may be conducted at a temperature of 0 to 100 °C, preferably 30 to 80 °C, and usually may be kept for 0.5 to 5 hours. Compound (c) may be used in the next step as a crude product or after purification by any conventional method such as column chromatography, recrystallization and the like.

### **Step 3**

**[0105]** The compound of the invention represented by the formula (I') can be prepared by reacting compound (c) with a compound of formula: HA-(CH<sub>2</sub>)<sub>u</sub>-azacyclic group in an appropriate solvent. The compound of formula HA-(CH<sub>2</sub>)<sub>u</sub>-azacyclic group can be used in 1 to 2 equivalents, preferably 1 to 1.5 equivalents relative to compound (c). Examples of the solvent which can be used include ethers (e.g., diethyl ether, tetrahydrofuran, dioxane, etc.), hydrocarbons (e.g., benzene, toluene, xylene, etc.), alcohols (e.g., methanol, ethanol, n-propanol, etc.), water, a mixture thereof, and the like. The reaction temperature may be 0 to 150 °C, preferably 20 to 120 °C, and the reaction time generally may be 0.5 to 10 hours. The desired compound (I') thus obtained, if necessary, may be purified by column chromatography, recrystallization or the like, for example.

EXAMPLES

[0106] The present invention is further described by the following Reference Examples and Examples, which are not intended to limit the scope of the present invention.

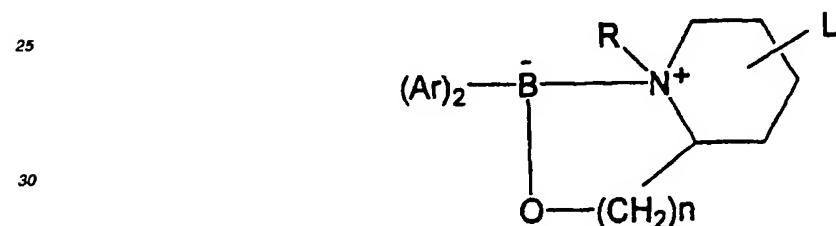
5 [0107] In the following Reference Examples and Examples, Ph, Naph, Me<sub>3</sub>Si-Ph and t-Bu represent phenyl group, naphthyl group, trimethylsilylphenyl group and t-butyl group, respectively.

## Reference Example 1

10 Synthesis of diphenylborate ethanolamine ester (Ph<sub>2</sub>B-OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>)

[0108] A solution of phenyl magnesium bromide in tetrahydrofuran was prepared according to a conventional method using 83.2 g (0.53 mol) of bromobenzene, 12.9 g (0.53 mol) of magnesium and 250 ml of tetrahydrofuran. Subsequently, 58.5 g (0.26 mol) of tributyl borate ester and 200 ml of ethyl ether were contained in a flask, and the flask was cooled at -60 °C. To the mixture was added dropwise a solution of phenyl magnesium bromide (Grignard reagent) in tetrahydrofuran while maintaining the temperature at -60 °C. After the addition was completed, the reaction mixture was stirred for 10 hours at room temperature and hydrolyzed by addition of 150 ml of a 10% aqueous hydrochloric acid, followed by isolating the organic layer. To the organic layer were added 31.1 g (0.51 mol) of ethanolamine and 50 ml of ethanol, and the mixture was stirred for two hours at room temperature. The precipitated product was collected by filtration, recrystallized from a hydrous alcohol, and dried to afford 31.9 g (yield 55%) of diphenylborate ethanolamine ester as white crystals.

15 [0109] Examples 1-4 as shown below describe the preparations of compounds represented by the formula:

35 Example 1

Synthesis of compound 1 of the formula wherein n is 1, Ar is phenyl, and R and L are hydrogen

40 [0110] A mixture of 2.6 g (0.012 mol) of diphenylborate ethanolamine ester, 30 ml of ethyl ether and 30 ml of 10% aqueous hydrochloric acid that was contained in a funnel was mixed with shaking for about 15 minutes, and the layers were then separated. The organic layer was washed once with water and transferred to an eggplant type flask. Subsequently, 2.1 g (0.018 mol) of 2-hydroxymethylpiperidine and 7 ml of ethanol were added thereto, and the mixture was stirred for two hours at room temperature. The precipitated product was collected by filtration, recrystallized from a hydrous alcohol, and dried to afford 2.8 g (yield 83%) of compound 1 as white crystals.

45 Mp: 169-171°C

Example 2

Synthesis of compound 2 of the formula wherein n is 1, Ar is 2-methylphenyl, and R and L are hydrogen

50 [0111] Di-(2-methyl)-phenylboronic acid ethanolamine ester (3.04 g, 0.012 mol) and 2-hydroxymethylpiperidine (2.10 g, 0.018 mol) were reacted and treated in a similar manner to the synthesis of compound 1 to afford 2.18 g (yield 78%) of compound 2 as white crystals.

55 Mp: 126-128 °C

Example 3

## Synthesis of compound 9

- 5 [0112] Di-(3-chloro)-phenylboronic acid ethanolamine ester (3.54 g, 0.012 mol) and 2-hydroxymethylpiperidine (2.10 g, 0.018 mol) were reacted and treated in a similar manner to the synthesis of compound 1 to afford 3.28 g (yield 78%) of compound 9 as white crystals.  
Mp: 155-159 °C

10 Example 4Synthesis of compound 31 of the formula wherein n is 1, Ar is  $\alpha$ -naphthyl, and R and L are hydrogen

- 15 [0113] Di- $\alpha$ -naphthylboronic acid ethanolamine ester (3.90 g, 0.012 mol) and 2-hydroxymethylpiperidine (2.10 g, 0.018 mol) were reacted and treated in a similar manner to the synthesis of compound 1 to afford 3.01 g (yield 79%) of compound 31 as white crystals.  
Mp: 176-178 °C  
[0114] The following compounds listed in Tables 1-6 can be prepared with reference to Examples 1-4 as described above.

20

Table 1

Compound No.	n	Ar	R	L	m.p. (°C)
1	1	Ph	H	H	169-171
25	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	H	H	126-128
3	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	H	H	203-205
4	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	H	H	134-136
5	1	2-F-Ph	H	H	
30	1	3-F-Ph	H	H	
6	1	4-F-Ph	H	H	134-136
7	1	2-Cl-Ph	H	H	
8	1	3-Cl-Ph	H	H	155-159
9	1	4-Cl-Ph	H	H	
10	1	2-Br-Ph	H	H	
35	1	3-Br-Ph	H	H	
11	1	4-Br-Ph	H	H	
12	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	H	H	
13	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	H	H	
40	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	H	95-97
14	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	H	
15	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	H	148-151
16	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	H	
17	1	2-tBu-Ph	H	H	
45	1	2-OPh-Ph	H	H	
18	1	3-OPh-Ph	H	H	
19	1	4-OPh-Ph	H	H	
20	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	H	
45	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	H	
21	1	2-CI,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	H	
22	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	H	H	
50	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	H	H	
23	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	H	
24	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	H	
55	1	$\alpha$ -Naph	H	H	176-178
25	1				
30	1				
35	1				
40	1				
45	1				
50	1				
55	1				
31	1				

## EP 1 155 698 A1

Table 1 (continued)

Compound No.	n	Ar	R	L	m.p. (°C)
32	1	β-Naph	H	H	
33	1	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	H	H	

Table 2

Compound No.	n	Ar	R	L	m.p. (°C)
34	2	Ph	H	H	
35	2	2-CH <sub>3</sub> -Ph	H	H	
36	2	3-CH <sub>3</sub> -Ph	H	H	
37	2	4-CH <sub>3</sub> -Ph	H	H	
38	2	2-F-Ph	H	H	
39	2	3-F-Ph	H	H	
40	2	4-F-Ph	H	H	
41	2	2-Cl-Ph	H	H	
42	2	3-Cl-Ph	H	H	
43	2	4-Cl-Ph	H	H	
44	2	2-Br-Ph	H	H	
45	2	3-Br-Ph	H	H	
46	2	4-Br-Ph	H	H	
47	2	2-CF <sub>3</sub> -Ph	H	H	
48	2	3-CF <sub>3</sub> -Ph	H	H	
49	2	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	H	
50	2	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	H	
51	2	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	H	
52	2	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	H	
53	2	4-tBu-Ph	H	H	
54	2	2-OPh-Ph	H	H	
55	2	3-OPh-Ph	H	H	
56	2	4-OPh-Ph	H	H	
57	2	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	H	
58	2	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	H	
59	2	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	H	
60	2	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	H	H	
61	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	H	H	
62	2	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	H	
63	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	H	
64	2	α-Naph	H	H	
65	2	β-Naph	H	H	
66	2	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	H	H	

Table 3

Compound No.	n	Ar	R	L	m.p. (°C)
67	1	Ph	CH <sub>3</sub>	H	
68	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
69	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
70	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
71	1	2-F-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
72	1	3-F-Ph	CH <sub>3</sub>	H	

Table 3 (continued)

Compound No.	n	Ar	R	L	m.p. (°C)
5	73	1	4-F-Ph	CH <sub>3</sub>	H
	74	1	2-Cl-Ph	CH <sub>3</sub>	H
	75	1	3-Cl-Ph	CH <sub>3</sub>	H
	76	1	4-Cl-Ph	CH <sub>3</sub>	H
	77	1	2-Br-Ph	CH <sub>3</sub>	H
10	78	1	3-Br-Ph	CH <sub>3</sub>	H
	79	1	4-Br-Ph	CH <sub>3</sub>	H
	80	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H
	81	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H
	82	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H
15	83	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H
	84	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H
	85	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H
	86	1	4-tBu-Ph	CH <sub>3</sub>	H
	87	1	2-OPh-Ph	CH <sub>3</sub>	H
20	88	1	3-OPh-Ph	CH <sub>3</sub>	H
	89	1	4-OPh-Ph	CH <sub>3</sub>	H
	90	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H
	91	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H
	92	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H
25	93	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	CH <sub>3</sub>	H
	94	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	CH <sub>3</sub>	H
	95	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H
	96	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H
	97	1	α-Naph	CH <sub>3</sub>	H
30	98	1	β-Naph	CH <sub>3</sub>	H
	99	1	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	CH <sub>3</sub>	H

35

Table 4

Compound No.	n	Ar	R	L	m.p. (°C)
40	100	2	Ph	CH <sub>3</sub>	H
	101	2	2-CH <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H
	102	2	3-CH <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H
	103	2	4-CH <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H
	104	2	2-F-Ph	CH <sub>3</sub>	H
45	105	2	3-F-Ph	CH <sub>3</sub>	H
	106	2	4-F-Ph	CH <sub>3</sub>	H
	107	2	2-Cl-Ph	CH <sub>3</sub>	H
	108	2	3-Cl-Ph	CH <sub>3</sub>	H
	109	2	4-Cl-Ph	CH <sub>3</sub>	H
50	110	2	2-Br-Ph	CH <sub>3</sub>	H
	111	2	3-Br-Ph	CH <sub>3</sub>	H
	112	2	4-Br-Ph	CH <sub>3</sub>	H
	113	2	2-CF <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H
	114	2	3-CF <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H
55	115	2	4-CF <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H
	116	2	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H
	117	2	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H

Table 4 (continued)

Compound No.	n	Ar	R	L	m.p. (°C)
118	2	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	5
119	2	4-tBu-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
120	2	2-OPh-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
121	2	3-OPh-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
122	2	4-OPh-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
123	2	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	10
124	2	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
125	2	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
126	2	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
127	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
128	2	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	15
129	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
130	2	α-Naph	CH <sub>3</sub>	H	
131	2	β-Naph	CH <sub>3</sub>	H	
132	2	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	CH <sub>3</sub>	H	

20

Table 5

Compound No.	n	Ar	R	L	m.p. (°C)
133	1	Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	25
134	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
135	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
136	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
137	1	2-F-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
138	1	3-F-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	30
139	1	4-F-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
140	1	2-Cl-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
141	1	3-Cl-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
142	1	4-Cl-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
143	1	2-Br-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	35
144	1	3-Br-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
145	1	4-Br-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
146	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
147	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
148	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	40
149	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
150	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
151	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
152	1	4-tBu-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
153	1	2-OPh-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	45
154	1	3-OPh-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
155	1	4-OPh-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
156	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
157	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
158	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	50
159	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
160	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
161	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
162	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	

## EP 1 155 698 A1

Table 5 (continued)

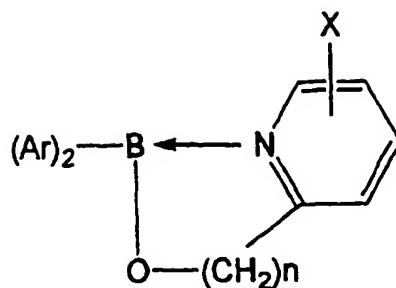
Compound No.	n	Ar	R	L	m.p. (°C)
163	1	α-Naph	H	6-CH <sub>3</sub>	
164	1	β-Naph	H	6-CH <sub>3</sub>	
165	1	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	

Table 6

Compound No.	n	Ar	R	L	m.p. (°C)
166	1	Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
167	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
168	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
169	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
170	1	2-F-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
171	1	3-F-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
172	1	4-F-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
173	1	2-Cl-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
174	1	3-Cl-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
175	1	4-Cl-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
176	1	2-Br-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
177	1	3-Br-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
178	1	4-Br-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
179	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
180	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
181	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
182	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
183	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
184	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
185	1	4-tBu-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
186	1	2-OPh-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
187	1	3-OPh-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
188	1	4-OPh-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
189	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
190	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
191	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
192	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
193	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
194	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
195	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
196	1	α-Naph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
197	1	β-Naph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
198	1	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	

50 [0115] Examples 5 and 6 as shown below describe the preparation of compounds represented by the formula:

5



10

15 Example 5

Synthesis of compound 199 of the formula wherein n is 1, Ar is phenyl, and X is hydrogen

[0116] A mixture of 2.6 g (0.012 mol) of diphenylborate ethanalamine ester, 30 ml of ethyl ether and 30 ml of a 10% aqueous hydrochloric acid that was contained in a funnel was mixed with shaking for about 15 minutes, and the layers were then separated. The organic layer was washed once with water and transferred to an eggplant type flask.

[0117] To the mixture were added 1.94 g (0.018 mol) of 2-hydroxymethyl pyridine and 7 ml of ethanol, and the mixture was stirred for two hours at the room temperature. The precipitated product was collected by filtration, recrystallized from a hydrous alcohol and dried to afford 2.5 g (yield 76%) of compound 199 as white crystals.

25 Mp: 150-151°C

Example 6

Synthesis of compound 246 of the formula wherein n is 2, Ar is 3-trifluoromethyl, and X is hydrogen

30 [0118] Di-(3-trifluoromethyl)-phenylboronic acid ethanalamine ester (2.77 g, 0.012 mol) and 2-hydroxyethylpyridine (2.21 g, 0.018 mol) were reacted and treated in a similar manner to the synthesis of compound 1 to afford 3.96 g (yield 78%) of compound 246 as white crystals.

Mp: 140-142 °C

35 [0119] The following compounds listed in Tables 7-20 can be prepared with reference to Examples 5 and 6 as described above.

Table 7

Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
199	1	Ph	H	150-151
200	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	H	188-192
201	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	H	117-119
202	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	H	147-149
203	1	2-F-Ph	H	
204	1	3-F-Ph	H	
205	1	4-F-Ph	H	137-139
206	1	2-Cl-Ph	H	
207	1	3-Cl-Ph	H	
208	1	4-Cl-Ph	H	133-134
209	1	2-Br-Ph	H	
210	1	3-Br-Ph	H	
211	1	4-Br-Ph	H	
212	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
213	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
214	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	92-94

Table 7 (continued)

	Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
5	215	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	163-165
	216	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	
	217	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	129-131
	218	1	2-OPh-Ph	H	
	219	1	3-OPh-Ph	H	
10	220	1	4-OPh-Ph	H	
	221	1	4-tBu-Ph	H	
	222	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	
	223	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	
	224	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
15	225	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	H	
	226	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	H	
	227	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
	228	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
	229	1	α-Naph	H	233-236
20	230	1	β-Naph	H	
	231	1	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	H	

Table 8

	Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
25	232	2	Ph	H	176-178
	233	2	2-CH <sub>3</sub> -Ph	H	208-211
	234	2	3-CH <sub>3</sub> -Ph	H	
	235	2	4-CH <sub>3</sub> -Ph	H	
	236	2	2-F-Ph	H	
30	237	2	3-F-Ph	H	
	238	2	4-F-Ph	H	118-120
	239	2	2-Cl-Ph	H	
	240	2	3-Cl-Ph	H	
	241	2	4-Cl-Ph	H	140-142
35	242	2	2-Br-Ph	H	
	243	2	3-Br-Ph	H	
	244	2	4-Br-Ph	H	
	245	2	2-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
	246	2	3-CF <sub>3</sub> -Ph	H	140-142
40	247	2	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
	248	2	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	
	249	2	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	
	250	2	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	131-133
	251	2	4-tBu-Ph	H	
45	252	2	2-OPh-Ph	H	
	253	2	3-OPh-Ph	H	
	254	2	4-OPh-Ph	H	
	255	2	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	
	256	2	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	
50	257	2	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
	258	2	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	H	
	259	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	H	

EP 1 155 698 A1

Table 8 (continued)

Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
260	2	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
261	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
262	2	α-Naph	H	215-218
263	2	β-Naph	H	
264	2	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	H	

10

Table 9

Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
265	1	Ph	2-Cl	
266	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
267	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
268	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
269	1	2-F-Ph	2-Cl	
270	1	3-F-Ph	2-Cl	
271	1	4-F-Ph	2-Cl	
272	1	2-Cl-Ph	2-Cl	
273	1	3-Cl-Ph	2-Cl	
274	1	4-Cl-Ph	2-Cl	
275	1	2-Br-Ph	2-Cl	
276	1	3-Br-Ph	2-Cl	
277	1	4-Br-Ph	2-Cl	
278	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
279	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
280	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
281	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
282	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
283	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
284	1	4-tBu-Ph	2-Cl	
285	1	2-OPh-Ph	2-Cl	
286	1	3-OPh-Ph	2-Cl	
287	1	4-OPh-Ph	2-Cl	
288	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	2-Cl	
289	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	2-Cl	
290	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
291	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	2-Cl	
292	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	2-Cl	
293	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
294	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
295	1	α-Naph	2-Cl	
296	1	β-Naph	2-Cl	
297	1	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	2-Cl	

5

10

20

25

30

35

40

45

50

Table 10

Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
298	2	Ph	2-Cl	
299	2	2-CH <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
300	2	3-CH <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	

## EP 1 155 698 A1

Table 10 (continued)

	Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
5	301	2	4-CH <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
	302	2	2-F-Ph	2-Cl	
	303	2	3-F-Ph	2-Cl	
	304	2	4-F-Ph	2-Cl	
	305	2	2-Cl-Ph	2-Cl	
10	306	2	3-Cl-Ph	2-Cl	
	307	2	4-Cl-Ph	2-Cl	
	308	2	2-Br-Ph	2-Cl	
	309	2	3-Br-Ph	2-Cl	
	310	2	4-Br-Ph	2-Cl	
15	311	2	2-CF <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
	312	2	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
	313	2	4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
	314	2	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
	315	2	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
20	316	2	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
	317	2	4-tBu-Ph	2-Cl	
	318	2	2-OPh-Ph	2-Cl	
	319	2	3-OPh-Ph	2-Cl	
	320	2	4-OPh-Ph	2-Cl	
25	321	2	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	2-Cl	
	322	2	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	2-Cl	
	323	2	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
	324	2	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	2-Cl	
	325	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	2-Cl	
30	326	2	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
	327	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
	328	2	α-Naph	2-Cl	
	329	2	β-Naph	2-Cl	
	330	2	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	2-Cl	

Table 11

	Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
40	331	1	Ph	3-Cl	
	332	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
	333	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
	334	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
	335	1	2-F-Ph	3-Cl	
45	336	1	3-F-Ph	3-Cl	
	337	1	4-F-Ph	3-Cl	
	338	1	2-Cl-Ph	3-Cl	
	339	1	3-Cl-Ph	3-Cl	
	340	1	4-Cl-Ph	3-Cl	
50	341	1	2-Br-Ph	3-Cl	
	342	1	3-Br-Ph	3-Cl	
	343	1	4-Br-Ph	3-Cl	
	344	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
	345	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	

Table 11 (continued)

	Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
5	346	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
	347	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
	348	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
	349	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
	350	1	2-OPh-Ph	3-Cl	
10	351	1	4-tBu-Ph	3-Cl	
	352	1	3-OPh-Ph	3-Cl	
	353	1	4-OPh-Ph	3-Cl	
	354	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	3-Cl	
	355	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	3-Cl	
15	356	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
	357	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	3-Cl	
	358	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	3-Cl	
	359	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
	360	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
20	361	1	α-Naph	3-Cl	
	362	1	β-Naph	3-Cl	
	363	1	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	3-Cl	

25

Table 12

	Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
30	364	2	Ph	3-Cl	
	365	2	2-CH <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
	366	2	3-CH <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
	367	2	4-CH <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
	368	2	2-F-Ph	3-Cl	
35	369	2	3-F-Ph	3-Cl	
	370	2	4-F-Ph	3-Cl	
	371	2	2-Cl-Ph	3-Cl	
	372	2	3-Cl-Ph	3-Cl	
	373	2	4-Cl-Ph	3-Cl	
40	374	2	2-Br-Ph	3-Cl	
	375	2	3-Br-Ph	3-Cl	
	376	2	4-Br-Ph	3-Cl	
	377	2	2-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
	378	2	3-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
45	379	2	4-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
	380	2	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
	381	2	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
	382	2	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
	383	2	4-tBu-Ph	3-Cl	
50	384	2	2-OPh-Ph	3-Cl	
	385	2	3-OPh-Ph	3-Cl	
	386	2	4-OPh-Ph	3-Cl	
	387	2	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	3-Cl	
	388	2	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	3-Cl	
55	389	2	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
	390	2	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	3-Cl	

EP 1 155 698 A1

Table 12 (continued)

Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
391	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	3-Cl	
392	2	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
393	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
394	2	α-Naph	3-Cl	
395	2	β-Naph	3-Cl	
396	2	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	3-Cl	

5

10

Table 13

Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
397	1	Ph	4-Cl	
398	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
399	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
400	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
401	1	2-F-Ph	4-Cl	
402	1	3-F-Ph	4-Cl	
403	1	4-F-Ph	4-Cl	
404	1	2-Cl-Ph	4-Cl	
405	1	3-Cl-Ph	4-Cl	
406	1	4-Cl-Ph	4-Cl	
407	1	2-Br-Ph	4-Cl	
408	1	3-Br-Ph	4-Cl	
409	1	4-Br-Ph	4-Cl	
410	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
411	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
412	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
413	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
414	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
415	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
416	1	4-tBu-Ph	4-Cl	
417	1	2-OPh-Ph	4-Cl	
418	1	3-OPh-Ph	4-Cl	
419	1	4-OPh-Ph	4-Cl	
420	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-Cl	
421	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-Cl	
422	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
423	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	4-Cl	
424	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	4-Cl	
425	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
426	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
427	1	α-Naph	4-Cl	
428	1	β-Naph	4-Cl	
429	1	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	4-Cl	

15

20

25

30

35

40

45

50

Table 14

Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
430	2	Ph	4-Cl	
431	2	2-CH <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	

55

EP 1 155 698 A1

Table 14 (continued)

	Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
5	432	2	3-CH <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
	433	2	4-CH <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
	434	2	2-F-Ph	4-Cl	
	435	2	3-F-Ph	4-Cl	
	436	2	4-F-Ph	4-Cl	
	437	2	2-Cl-Ph	4-Cl	
10	438	2	3-Cl-Ph	4-Cl	
	439	2	4-Cl-Ph	4-Cl	
	440	2	2-Br-Ph	4-Cl	
	441	2	3-Br-Ph	4-Cl	
	442	2	4-Br-Ph	4-Cl	
	443	2	2-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
15	444	2	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
	445	2	4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
	446	2	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
	447	2	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
	448	2	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
	449	2	4-tBu-Ph	4-Cl	
20	450	2	2-OPh-Ph	4-Cl	
	451	2	3-OPh-Ph	4-Cl	
	452	2	4-OPh-Ph	4-Cl	
	453	2	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-Cl	
	454	2	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-Cl	
	455	2	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
25	456	2	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	4-Cl	
	457	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	4-Cl	
	458	2	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
	459	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
	460	2	α-Naph	4-Cl	
	461	2	β-Naph	4-Cl	
30	462	2	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	4-Cl	
35					

Table 15

	Compound No.	n	AT	X	m.p. (°C)
40	463	1	Ph	4-CF <sub>3</sub>	
	464	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
	465	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
	466	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
	467	1	2-F-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
	468	1	3-F-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
45	469	1	4-F-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
	470	1	2-Cl-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
	471	1	3-Cl-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
	472	1	4-Cl-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
	473	1	2-Br-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
	474	1	3-Br-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
50	475	1	4-Br-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
	476	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
55					

EP 1 155 698 A1

Table 15 (continued)

Compound No.	n	AT	X	m.p. (°C)
477	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
478	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
479	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
480	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
481	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
482	1	4-tBu-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
483	1	2-OPh-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
484	1	3-OPh-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
485	1	4-OPh-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
486	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
487	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
488	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
489	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
490	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
491	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
492	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
493	1	α-Naph	4-CF <sub>3</sub>	
494	1	β-Naph	4-CF <sub>3</sub>	
495	1	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	4-CF <sub>3</sub>	

25

Table 16

Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
496	2	Ph	4-CF <sub>3</sub>	
497	2	2-CH <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
498	2	3-CH <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
499	2	4-CH <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
500	2	2-F-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
501	2	3-F-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
502	2	4-F-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
503	2	2-Cl-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
504	2	3-Cl-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
505	2	4-Cl-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
506	2	2-Br-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
507	2	3-Br-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
508	2	4-Br-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
509	2	2-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
510	2	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
511	2	4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
512	2	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
513	2	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
514	2	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
515	2	4-tBu-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
516	2	2-OPh-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
517	2	3-OPh-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
518	2	4-OPh-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
519	2	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
520	2	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
521	2	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	

EP 1 155 698 A1

Table 16 (continued)

	Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
5	522	2	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
	523	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
	524	2	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
10	525	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
	526	2	α-Naph	4-CF <sub>3</sub>	
	527	2	β-Naph	4-CF <sub>3</sub>	
	528	2	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	4-CF <sub>3</sub>	

Table 17

	Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
15	529	1	Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	530	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	531	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
20	532	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	533	1	2-F-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	534	1	3-F-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	535	1	4-F-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
25	536	1	2-Cl-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	537	1	3-Cl-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	538	1	4-Cl-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	539	1	2-Br-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	540	1	3-Br-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
30	541	1	4-Br-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	542	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	543	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	544	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	545	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
35	546	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	547	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	548	1	4-tBu-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	549	1	2-OPh-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
40	550	1	3-OPh-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	551	1	4-OPh-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	552	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	553	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
45	554	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	555	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	556	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	557	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
50	558	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	559	1	α-Naph	5-CF <sub>3</sub>	
	560	1	β-Naph	5-CF <sub>3</sub>	
	561	1	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	5-CF <sub>3</sub>	

Table 18

Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
562	2	Ph	5-CF <sub>3</sub>	

Table 18 (continued)

	Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
5	563	2	2-CH <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	564	2	3-CH <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	565	2	4-CH <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	566	2	2-F-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	567	2	3-F-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	568	2	4-F-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
10	569	2	2-Cl-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	570	2	3-Cl-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	571	2	4-Cl-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	572	2	2-Br-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	573	2	3-Br-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	574	2	4-Br-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
15	575	2	2-CF <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	576	2	3-CF <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	577	2	4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	578	2	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	579	2	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	580	2	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
20	581	2	4-tBu-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	582	2	2-OPh-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	583	2	3-OPh-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	584	2	4-OPh-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	585	2	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	586	2	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
25	587	2	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	588	2	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	589	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	590	2	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	591	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
	592	2	α-Naph	5-CF <sub>3</sub>	
30	593	2	β-Naph	5-CF <sub>3</sub>	
	594	2	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	5-CF <sub>3</sub>	

40

Table 19

	Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
45	628	1	Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	629	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	630	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	631	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	632	1	2-F-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	633	1	3-F-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
50	634	1	4-F-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	635	1	2-Cl-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	636	1	3-Cl-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	637	1	4-Cl-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	638	1	2-Br-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	639	1	3-Br-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
55	640	1	4-Br-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	

Table 19 (continued)

	Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
5	641	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	642	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	643	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	644	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	645	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
10	646	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	647	1	4-tBu-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	648	1	2-OPh-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	649	1	3-OPh-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	650	1	4-OPh-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
15	651	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	652	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	653	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	654	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	655	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
20	656	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	657	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	658	1	α-Naph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	659	1	β-Naph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	660	1	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	

Table 20

	Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
30	661	2	Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	662	2	2-CH <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	663	2	3-CH <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	664	2	4-CH <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	665	2	2-F-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
35	666	2	3-F-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	667	2	4-F-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	668	2	2-Cl-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	669	2	3-Cl-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	670	2	4-Cl-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
40	671	2	2-Br-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	672	2	3-Br-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	673	2	4-Br-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	674	2	2-CF <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	675	2	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
45	676	2	4-CF <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	677	2	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	678	2	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	679	2	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	680	2	4-tBu-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
50	681	2	2-OPh-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	682	2	3-OPh-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	683	2	4-OPh-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	684	2	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	685	2	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	

Table 20 (continued)

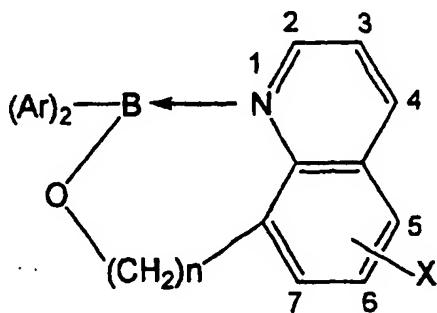
	Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
5	686	2	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	687	2	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	688	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	689	2	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
10	690	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	691	2	α-Naph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	692	2	β-Naph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
	693	2	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	

[0120] Examples 7-9 as shown below describe the preparation of compounds represented by the formula:

15

20

25



30 Example 7

Synthesis of compound 697 of the formula wherein n is 0, Ar is 4-methylphenyl, and X is hydrogen

[0121] Di-(4-methyl)-phenylboronic acid ethanolamine ester (3.04 g, 0.012 mol) and 8-oxyquinoline (2.61 g, 0.018 mol) were reacted and treated in a similar manner to the synthesis of compound 1 to afford 3.28 g (yield 81%) of compound 697 as white crystals.

Mp: 203-205 °C

40 Example 8

Synthesis of compound 708 of the formula wherein n is 0, Ar is 3-trifluoromethylphenyl, and X is hydrogen

[0122] Di-(3-trifluoromethyl)-phenylboronic acid ethanolamine ester (2.77 g, 0.012 mol) and 8-oxyquinoline (2.61 g, 0.018 mol) were reacted and treated in a similar manner to the synthesis of compound 1 to afford 4.31 g (yield 80.8%) of compound 708 as white crystals.

Mp: 130-132 °C

45 Example 9

50 Synthesis of compound 724 of the formula wherein n is 0, Ar is α-naphthyl, and X is hydrogen

[0123] Di-α-naphthylboronic acid ethanolamine ester (3.90 g, 0.012 mol) and 8-oxyquinoline (2.61 g, 0.018 mol) were reacted and treated in a similar manner to the synthesis of compound 1 to afford 4.11 g (yield 86.3%) of compound 724 as white crystals.

55 Mp: 225-226 °C

[0124] The following compounds listed in Tables 21-32 can be prepared with reference to Examples 7-9 as described above.

Table 21

	Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
5	694	0	Ph	H	206-207
	695	0	2-CH <sub>3</sub> -Ph	H	189-191
	696	0	3-CH <sub>3</sub> -Ph	H	165-167
	697	0	4-CH <sub>3</sub> -Ph	H	203-205
	698	0	2-F-Ph	H	
10	699	0	3-F-Ph	H	
	700	0	4-F-Ph	H	167-169
	701	0	2-Cl-Ph	H	
	702	0	3-Cl-Ph	H	
	703	0	4-Cl-Ph	H	181-182
15	704	0	2-Br-Ph	H	
	705	0	3-Br-Ph	H	
	706	0	4-Br-Ph	H	
	707	0	2-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
	708	0	3-CF <sub>3</sub> -Ph	H	130-132
20	709	0	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
	710	0	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	199-200
	711	0	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	
	712	0	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	212-214
	713	0	4-tBu-Ph	H	
25	714	0	2-OPh-Ph	H	
	715	0	3-OPh-Ph	H	
	716	0	4-OPh-Ph	H	
	717	0	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	
	718	0	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	
30	719	0	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
	720	0	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	H	
	721	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	H	
	722	0	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
	723	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
35	724	0	α-Naph	H	225-226
	725	0	β-Naph	H	
	726	0	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	H	

Table 22

	Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
45	727	1	Ph	H	
	728	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	H	
	729	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	H	
	730	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	H	
	731	1	2-F-Ph	H	
50	732	1	3-F-Ph	H	
	733	1	4-F-Ph	H	
	734	1	2-Cl-Ph	H	
	735	1	3-Cl-Ph	H	
	736	1	4-Cl-Ph	H	
55	737	1	2-Br-Ph	H	

## EP 1 155 698 A1

Table 22 (continued)

	Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
5	738	1	3-Br-Ph	H	
	739	1	4-Br-Ph	H	
	740	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
	741	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
	742	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
10	743	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	
	744	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	
	745	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	
	746	1	4-tBu-Ph	H	
	747	1	2-OPh-Ph	H	
15	748	1	3-OPh-Ph	H	
	749	1	4-OPh-Ph	H	
	750	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	
	751	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	
	752	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
20	753	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	H	
	754	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	H	
	755	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
	756	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
	757	1	α-Naph	H	
25	758	1	β-Naph	H	
	759	1	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	H	

30

Table 23

	Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
35	760	0	Ph	5-Cl	
	761	0	2-CH <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
	762	0	3-CH <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
	763	0	4-CH <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
	764	0	2-F-Ph	5-Cl	
40	765	0	3-F-Ph	5-Cl	
	766	0	4-F-Ph	5-Cl	
	767	0	2-Cl-Ph	5-Cl	
	768	0	3-Cl-Ph	5-Cl	
	769	0	4-Cl-Ph	5-Cl	
45	770	0	2-Br-Ph	5-Cl	
	771	0	3-Br-Ph	5-Cl	
	772	0	4-Br-Ph	5-Cl	
	773	0	2-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
	774	0	3-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
50	775	0	4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
	776	0	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
	777	0	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
	778	0	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
	779	0	4-tBu-Ph	5-Cl	
55	780	0	2-OPh-Ph	5-Cl	
	781	0	3-OPh-Ph	5-Cl	
	782	0	4-OPh-Ph	5-Cl	

## EP 1 155 698 A1

Table 23 (continued)

	Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
5	783	0	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-Cl	
	784	0	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-Cl	
	785	0	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
	786	0	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	5-Cl	
	787	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	5-Cl	
10	788	0	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
	789	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
	790	0	α-Naph	5-Cl	
	791	0	β-Naph	5-Cl	
	792	0	4- Me <sub>3</sub> Si-Ph	5-Cl	

15

Table 24

	Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
20	793	1	Ph	5-Cl	
	794	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
	795	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
	796	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
	797	1	2-F-Ph	5-Cl	
25	798	1	3-F-Ph	5-Cl	
	799	1	4-F-Ph	5-Cl	
	800	1	2-Cl-Ph	5-Cl	
	801	1	3-Cl-Ph	5-Cl	
	802	1	4-Cl-Ph	5-Cl	
30	803	1	2-Br-Ph	5-Cl	
	804	1	3-Br-Ph	5-Cl	
	805	1	4-Br-Ph	5-Cl	
	806	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
	807	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
35	808	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
	809	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
	810	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
	811	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
	812	1	4-tBu-Ph	5-Cl	
40	813	1	2-OPh-Ph	5-Cl	
	814	1	3-OPh-Ph	5-Cl	
	815	1	4-OPh-Ph	5-Cl	
	816	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-Cl	
	817	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-Cl	
45	818	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
	819	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	5-Cl	
	820	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	5-Cl	
	821	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
	822	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
50	823	1	α-Naph	5-Cl	
	824	1	β-Naph	5-Cl	
	825	1	4- Me <sub>3</sub> Si-Ph	5-Cl	

Table 25

	Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
5	826	0	Ph	7-Cl	
	827	0	2-CH <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
	828	0	3-CH <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
	829	0	4-CH <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
10	830	0	2-F-Ph	7-Cl	
	831	0	3-F-Ph	7-Cl	
	832	0	4-F-Ph	7-Cl	
	833	0	2-Cl-Ph	7-Cl	
	834	0	3-Cl-Ph	7-Cl	
15	835	0	4-Cl-Ph	7-Cl	
	836	0	2-Br-Ph	7-Cl	
	837	0	3-Br-Ph	7-Cl	
	838	0	4-Br-Ph	7-Cl	
20	839	0	2-CF <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
	840	0	3-CF <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
	841	0	4-CF <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
	842	0	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
	843	0	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
25	844	0	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
	845	0	4-tBu-Ph	7-Cl	
	846	0	2-OPh-Ph	7-Cl	
	847	0	3-OPh-Ph	7-Cl	
	848	0	4-OPh-Ph	7-Cl	
30	849	0	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	7-Cl	
	850	0	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	7-Cl	
	851	0	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
	852	0	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	7-Cl	
35	853	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	7-Cl	
	854	0	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
	855	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
	856	0	α-Naph	7-Cl	
	857	0	β-Naph	7-Cl	
40	858	0	4- Me <sub>3</sub> Si-Ph	7-Cl	

Table 26

	Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
45	859	1	Ph	7-Cl	
	860	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
	861	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
	862	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
50	863	1	2-F-Ph	7-Cl	
	864	1	3-F-Ph	7-Cl	
	865	1	4-F-Ph	7-Cl	
	866	1	2-Cl-Ph	7-Cl	
	867	1	3-Cl-Ph	7-Cl	
	868	1	4-Cl-Ph	7-Cl	
55	869	1	2-Br-Ph	7-Cl	

## EP 1 155 698 A1

Table 26 (continued)

	Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
5	870	1	3-Br-Ph	7-Cl	
	871	1	4-Br-Ph	7-Cl	
	872	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
	873	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
	874	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
10	875	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
	876	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
	877	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
	878	1	4-tBu-Ph	7-Cl	
	879	1	2-OPh-Ph	7-Cl	
15	880	1	3-OPh-Ph	7-Cl	
	881	1	4-OPh-Ph	7-Cl	
	882	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	7-Cl	
	883	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	7-Cl	
	884	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
20	885	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	7-Cl	
	886	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	7-Cl	
	887	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
	888	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
	889	1	α-Naph	7-Cl	
25	890	1	β-Naph	7-Cl	
	891	1	4- Me <sub>3</sub> Si-Ph	7-Cl	

Table 27

	Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
35	892	0	Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	893	0	2-CH <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	894	0	3-CH <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	895	0	4-CH <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	896	0	2-F-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
40	897	0	3-F-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	898	0	4-F-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	899	0	2-Cl-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	900	0	3-Cl-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	901	0	4-Cl-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
45	902	0	2-Br-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	903	0	3-Br-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	904	0	4-Br-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	905	0	2-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	906	0	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
50	907	0	4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	908	0	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	909	0	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	910	0	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	911	0	4-tBu-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
55	912	0	2-OPh-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	913	0	3-OPh-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	914	0	4-OPh-Ph	2-CH <sub>3</sub>	

Table 27 (continued)

	Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
5	915	0	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	916	0	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	917	0	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	918	0	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	919	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	920	0	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
10	921	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	922	0	α-Naph	2-CH <sub>3</sub>	
	923	0	β-Naph	2-CH <sub>3</sub>	
	924	0	4- Me <sub>3</sub> Si-Ph	2-CH <sub>3</sub>	

15

Table 28

	Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
20	925	2	Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	926	2	2-CH <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	927	2	3-CH <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	928	2	4-CH <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	929	2	2-F-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	930	2	3-F-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
25	931	2	4-F-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	932	2	2-Cl-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	933	2	3-Cl-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	934	2	4-Cl-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
30	935	2	2-Br-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	936	2	3-Br-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	937	2	4-Br-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	938	2	2-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	939	2	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	940	2	4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
35	941	2	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	942	2	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	943	2	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	944	2	4-tBu-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	945	2	2-OPh-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	946	2	3-OPh-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
40	947	2	4-OPh-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	948	2	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	949	2	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	950	2	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	951	2	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	952	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
45	953	2	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	954	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
	955	2	α-Naph	2-CH <sub>3</sub>	
	956	2	β-Naph	2-CH <sub>3</sub>	
	957	2	4- Me <sub>3</sub> Si-Ph	2-CH <sub>3</sub>	

Table 29

	Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
5	958	0	Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
	959	0	2-CH <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
	960	0	3-CH <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
	961	0	4-CH <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
	962	0	2-F-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
10	963	0	3-F-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
	964	0	4-F-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
	965	0	2-Cl-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
	966	0	3-Cl-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
	967	0	4-Cl-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
15	968	0	2-Br-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
	969	0	3-Br-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
	970	0	4-Br-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
	971	0	2-CF <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
	972	0	3-CF <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
20	973	0	4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
	974	0	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
	975	0	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
	976	0	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
	977	0	4-tBu-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
25	978	0	2-OPh-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
	979	0	3-OPh-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
	980	0	4-OPh-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
	981	0	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	-5-SO <sub>3</sub> H	
	982	0	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
30	983	0	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
	984	0	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
	985	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
	986	0	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
	987	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
35	988	0	α-Naph	5-SO <sub>3</sub> H	
	989	0	β-Naph	5-SO <sub>3</sub> H	
	990	0	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	

Table 30

	Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
45	991	0	Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
	992	0	2-CH <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
	993	0	3-CH <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
	994	0	4-CH <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
	995	0	2-F-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
50	996	0	3-F-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
	997	0	4-F-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
	998	0	2-Cl-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
	999	0	3-Cl-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
	1000	0	4-Cl-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
55	1001	0	2-Br-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	

## EP 1 155 698 A1

Table 30 (continued)

Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
1002	0	3-Br-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1003	0	4-Br-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1004	0	2-CF <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1005	0	3-CF <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1006	0	4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1007	0	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1008	0	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1009	0	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1010	0	4-tBu-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1011	0	2-OPh-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1012	0	3-OPh-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1013	0	4-OPh-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1014	0	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1015	0	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1016	0	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1017	0	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1018	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1019	0	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1020	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1021	0	α-Naph	5-SO <sub>3</sub> H	
1022	0	β-Naph	5-SO <sub>3</sub> H	
1023	0	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	

Table 31

Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
1024	0	Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1025	0	2-CH <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1026	0	3-CH <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1027	0	4-CH <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1028	0	2-F-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1029	0	3-F-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1030	0	4-F-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1031	0	2-Cl-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1032	0	3-Cl-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1033	0	4-Cl-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1034	0	2-Br-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1035	0	3-Br-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1036	0	4-Br-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1037	0	2-CF <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1038	0	3-CF <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1039	0	4-CF <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1040	0	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1041	0	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1042	0	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1043	0	4-tBu-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1044	0	2-OPh-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1045	0	3-OPh-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1046	0	4-OPh-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	

Table 31 (continued)

Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
1047	0	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1048	0	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1049	0	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1050	0	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1051	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1052	0	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1053	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1054	0	α-Naph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1055	0	β-Naph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1056	0	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	

15

Table 32

Compound No.	n	Ar	X	m.p. (°C)
1057	1	Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1058	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1059	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1060	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1061	1	2-F-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1062	1	3-F-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1063	1	4-F-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1064	1	2-Cl-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1065	1	3-Cl-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1066	1	4-Cl-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1067	1	2-Br-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1068	1	3-Br-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1069	1	4-Br-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1070	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1071	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1072	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1073	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1074	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1075	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1076	1	4-tBu-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1077	1	2-OPh-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1078	1	3-OPh-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1079	1	4-OPh-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1080	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1081	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1082	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1083	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1084	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1085	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1086	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1087	1	α-Naph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1088	1	β-Naph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1089	1	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	

[0125] The compounds of the invention can be formulated into a composition for preventing or treating coccidiosis

in poultry according to methods well known to the art. Specifically, the compounds of the invention can be formulated into the form of powder, granules, solution, suspension, premix, capsule, emulsion, tablets, or the like, alone or together with any appropriate carrier commonly used for this kind of medicament, optionally using excipients, disintegrating agents, lubricants, coatings, etc.

- 5 [0126] Usually, the carriers used in the formulations of the invention are not limited so long as they are capable of being used as an additive in feed or drinking water for poultry. Examples of such carriers include water, lactose, sucrose, talc, colloidal silica, pectin, wheat flour, rice bran, cornmeal, soy beans, oilcake, cracked starch and other commercially available feed for poultry, and the like.
- 10 [0127] As to dose of the compound of the invention, in the case of use as an additive in feed, the bulk product may be generally mixed with the feed at a concentration of at least 0.1 to 500 ppm, preferably 0.5 to 100 ppm. In the case of use as an additive in drinking water, an approximate half concentration of the above can provide sufficient effectiveness.
- 15 [0128] Also, the compounds of the invention may be used associated with known veterinary medicaments including anticoccidial agents for poultry, anthelmintics, agents for preventing infections, growth promoting agents, or the like.

**15 Test Examples**

- [0129] Anticoccidial activity of the compounds of the invention was demonstrated in the following test examples. *In vitro* test of the anticoccidial agent for poultry of the invention was conducted as shown below.

**20 Test Example 1**

*In vitro* inhibitory activity of coccidial proliferation in chicken kidney (CK) cell culture

**25 1. Cell treatments**

- [0130] Kidney was aseptically removed from an SPF chick, and digested with trypsin in a publicly known method. The cells were washed, and the cell number was adjusted, before the cells were incubated at 37°C for 72 hours in a CO<sub>2</sub> incubator to give a cell monolayer. The cell monolayer was inoculated with a dilution of a defined concentration of test compounds and sporozoites of the *Eimeria tenella* oocysts that had been artificially excysted, and incubated at 40° C for 48 hours. The cells were fixed with alcohol, Giemsa-stained, and then observed as shown below.

**2. Observation and estimation**

- 35 [0131] The primary schizonts (mature and immature) divided and proliferated in the cytoplasm of the chicken kidney cells were observed under an inverted microscope, and the inhibitory rate of the protozoan proliferation was estimated on the basis of the schizont count relative to that of the control group wherein sporozoites that were not treated were inoculated.
- 40 [0132] At the same time, cytopathogenic effect (CPE) was additionally observed, and estimated on a scale of one to four (- to +++): -: no difference compared to the control group, +: slight change, ++: moderate change, and +++: death of whole cells (the protozoan was invisible).
- [0133] The results are shown in Table 33 as described below.

**45 Test Example 2**

*In vivo* estimation of prevention/treatment effect on coccidiosis in chicken chicks

- [0134] The compounds of the invention were sequentially administered in the form of feed (200 ppm or 400 ppm) so as to estimate for their effectiveness (anticoccidial effect) on *Eimeria tenella*.
- 50 [0135] One group consisted of three white Leghorn chicks aged seven to ten days, each of which chicks was administered with a feed supplemented with a test compound. On the second day after the administration, spore forming oocysts of *Eimeria tenella* were infected at 50,000 oocysts per chick. The test compounds were administered over a period of consecutive nine days, during which the hemorrhagic stool excretion, the survival rate, and the relative weight gain ratio were estimated, and, on the eighth day after the infection, the cecum lesion were observed at autopsy to estimate the lesion index.
- [0136] The criteria were as shown below.

Relative weight gain ratio:

[0137] is represented by the following expression:

5 Weight gain in test group + Weight gain in control group of uninfected chicks x 100 (%).

Hemorrhagic stool excretion:

10 [0138] Excretion of the hemorrhagic stool excreted during the test period was estimated on a scale of one to four as following. In the table, "d" represents the number of days after the administration of oocysts.

- : no hemorrhagic stool excretion was observed;
- + : a slight hemorrhagic stool excretion was observed;
- ++ : a moderate hemorrhagic stool excretion was observed; and
- +++ : a hemorrhagic stool excretion equal to that in the control group of the infected chicks was observed.

Cecum lesion index:

20 [0139] is in accordance with Merck assay.

[0140] Eight days after the infection, survived chicks were autopsied, and the cecum lesion was visually observed to determine the intensity caused during the period infection on a scale of zero to four (no lesion; 0, severe lesion; 4), thereby estimating the lesion severity at the average of five results.

25 [0141] The test results are shown in Table 33 with reference to those in the control group of the untreated, infected chicks, and in the control group of untreated, uninfected chicks.

Table 33

30 <i>In vitro</i> antiprotozoal activity ( <i>E. tenella</i> )				<i>In vivo</i> anticoccidial effect ( <i>E. tenella</i> )							
Comp. No	concentration ( $\mu\text{g/ml}$ )			dose (ppm in feed)	relative weight gain ratio (%)	hemorrhagic stool excretion			mortality (/)	OPG value	cecum lesion index (6d)
	10	1.0	0.1			4	5	6d			
	% (CPE)	% (CPE)	% (CPE)								
40 694	<0(-) (+++)	0.2 (-) 12.5 (-)	<0 (-) <0 (-)								
199	39.6 (-)	<0 (-)	<0 (-)								
45 232	32.2 (-)	0.9(-)	6.0(-)								
31	69.7 (-)	0 (-)	<0(-)	400	66.8	±	+++	++	0/3	None	4.0
50 724	(+++)	100 (-)	<0 (-)	400	58.9	±	+++	++	0/3	"	4.0
229	77.0 (-)	<0(-)	<0(-)	400	56.5	+	+++	++	0/3	"	4.0
55 262	60.4 (-)	0.9(-)	<0(-)	400	53.8	±	+++	+++	0/3	"	4.0
2	<0(-)	<0(-)	<0 (-)								
695	(+++)	(+++)	<0 (-)	400	61.5	+	+++	+++	0/3	"	3.7
200	<0 (-)	<0(-)	<0 (-)								

Table 33 (continued)

		<i>In vitro</i> antiprotozoal activity ( <i>E. tenella</i> )		<i>In vivo</i> anticoccidial effect ( <i>E. tenella</i> )						
5	Comp. No	concentration (µg/ml)	dose (ppm in feed)	relative weight gain ratio (%)	hemorrhagic stool excretion			mortality (/)	OPG value	cecum lesion index (6d)
10		10    1.0    0.1			4	5	6d			
15		% (CPE)    % (CPE)    % (CPE)								
233	<0 (-)	<0 (-)	<0 (-)							
3	19.3 (-)	<0 (-)	<0 (-)							
696	(+++)	90.7 (+)	30.5 (-)	400	61.5	+	+++	++	1/3	" 4.0
201	71.3 (-)	<0 (-)	<0 (-)	400	71.8	+	+++	++	1/3	" 4.0
4	<0 (-)	<0 (-)	<0 (-)							
697	(+++)	65.1 (±)	<0 (-)	400	76.9	±	+++	+++	1/3	" 3.7
202	44.2 (-)	<0 (-)	<0 (-)							
710	(+++)	<0 (-)	<0 (-)							
215	4.5 (-)	<0 (-)	1.8 (-)							
19	<0 (-)	<0 (-)	<0 (-)							
712	(+++)	28.8 (-)	<0 (-)							
217	14.5 (-)	<0 (-)	<0 (-)							
250	<0 (-)	2.4 (-)	<0 (-)							
703	(+++)	<0 (-)	<0 (-)							
208	17.2 (-)	<0 (-)	1.8 (-)							
241	14.0 (-)	<0 (-)	<0 (-)							
40	10	100 (+)	12.1 (-)	<0 (-)	400	82.5	-	-	0/3	" 0.0(H)
15	99.6 (+)	<0 (-)	<0 (-)	200	25.7	+	+++	++	0/3	" 4.0
45	708	(+++)	94.7 (++)	16.6 (-)	400	42.4	+	++	+++	0/3 " 4.0
213	100 (+)	13.0 (-)	<0 (-)	400	57.4	±	++	++	0/3	" 3.7
50	246	100 (+)	14.8 (-)	<0 (-)	400	82.5	-	+	++	0/3 " 3.3(S)
7	<0 (-)	<0 (-)	<0 (-)							
700	(+++)	99.8 (++)	30.6 (-)							
55	205	33.2 (±)	<0 (-)	<0 (-)						

Table 33 (continued)

<i>in vitro</i> antiprotozoal activity ( <i>E. tenella</i> )		<i>in vivo</i> anticoccidial effect ( <i>E. tenella</i> )							
Comp. No	concentration (µg/ml)	dose (ppm in feed)	relative weight gain ratio (%)	hemorrhagic stool excretion			mortality (%)	OPG value	cecum lesion index (6d)
10	10 % (CPE)	1.0 (CPE)	0.1 (CPE)		4	5	6d		
15	238 27.1 (±)	<0 (-) <0 (-)							

## Results:

[0142] Compounds 10 and 246, etc. explicitly provided improvements in the clinical conditions, the relative weight gain ratio, and the cecum lesion index. Especially, compound 10 caused no hemorrhagic stool excretion and no infectious sign, with any cecum not being affected.

Test Example 3

[0143] Additional *in vivo* test for compound 10

[0143] An additional *in vivo* test was conducted on compound 10, which was shown to provide good results in Test Examples 1 and 2.

[0144] Specifically, the effectiveness of compound 10 on *Eimeria tenella*, and *Eimeria acervulina* in broiler chicks in a similar manner to that in Test Example 2.

[0145] In this test, OPG value) that is the number of oocysts existing in one gram of the faeces, was also determined on the sixth day after the infection. In the determination of OPG value, the faeces were taken and scrambled thoroughly, and two grams of an aliquot was diluted 20 times with distilled water. A Fuchs-Rosenthal hemacytometer was used to conduct the counting, and to determine OPG value per one gram of the faeces. OPG value enables us to determine the prognostic severity of the infection according to the number of value. In general, the higher is OPG value, the severer is the disease.

[0146] The results are shown Tables 34 and 35.

40

45

50

55

5  
10  
15  
20  
25  
30  
35  
40  
45  
50  
55

Table 34  
Anticoccidial effect on *Elmeria teneilla* (broiler chicks)

Comp.No	Indose (ppm feed)	relative weight gain ratio (-1-8d) %	hemorrhagic stool excretion			mortality (%)	OPG value (8d)	cecum lesion index (8d)	estimation (x- ①)
			4	5	6				
Comp. 10	200	70.2(1)	-	-	-	0/3	0	0	①(1)*
	100	101.0	-	+	+	0/3	1.0x10 <sup>5</sup>	6.3x10 <sup>3</sup>	1.7*
	50	54.8	+	+++	++	0/3	2.8x10 <sup>5</sup>	9.8x10 <sup>4</sup>	4.0
	25	65.0	+	+++	++	0/3	1.3x10 <sup>5</sup>	4.3x10 <sup>4</sup>	4.0
	infective control	0	49.0	++	+++	±	1/3	1.9x10 <sup>5</sup>	4.0
normal control		0	100	-	-	-	0/3	0	0

\* diarrhea (+)

Table 35

Comp. No	dose (ppm in feed)	relative weight gain ratio (-1-5d) %	excretion of mucus faeces			mortal-ity (/)	OPG value		estimation (x-○)
			3	4	5d		4d	5d	
Comp. 10	200	82.3(T)	-	-	-	0/3	0	0	○ (T)*
	100	80.6	-	+	++	0/3	$6.6 \times 10^6$	$2.8 \times 10^6$	△*
	50	67.8	-	++	+++	0/3	$5.9 \times 10^6$	$1.7 \times 10^6$	x
	25	51.6	-	++	+++	0/3	$1.9 \times 10^7$	$6.2 \times 10^6$	x
infective control	0	54.9	-	++	+++	0/3	$1.7 \times 10^7$	$7.5 \times 10^6$	
normal control	0	100	-	-	-	0/3	0	0	

\* diarrhea (+)

## Results:

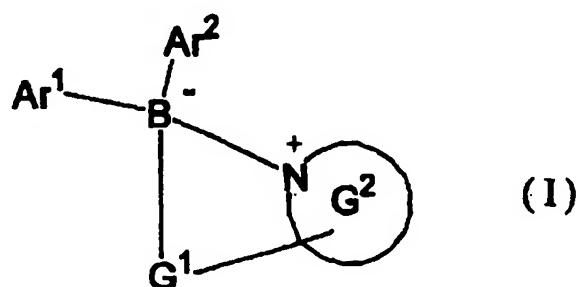
[0147] When administered to both *Eimeria tenella*, and *Eimeria acervulina* in the form of feed at 100ppm, compound 10 explicitly provided improvements in the clinical conditions, the relative weight gain ratio, and the cecum lesion index (only *Eimeria tenella*), demonstrating that compound 10 exhibits a excellent anticoccidial effect.

## EFFECTS OF THE INVENTION

[0148] As shown in the above test examples, the compounds of the present invention exhibit strong anticoccidial activities in chicken chicks, such as inhibition of the decrease in relative weight gain ratio, inhibition of hemorrhagic stool excretion, decrease in oocysts counts (OPG), improvement of cecum lesion index, and the like. Further, the compounds of the invention have a low toxicity as demonstrated by the data of mortality. Accordingly, the compounds of the invention are useful as compositions for preventing and treating coccidiosis in poultry such as chicken, turkey, ducks, or the like as well as livestock such as cattle, pig, or the like.

## Claims

1. A pharmaceutical composition useful for animals except for humans, which comprises a compound of formula (I):



55

in which

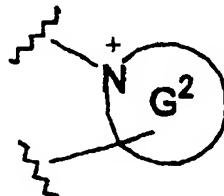
Ar<sup>1</sup> and Ar<sup>2</sup> are independently a cyclic group which may be optionally substituted; G<sup>1</sup> is a group of the formula: -A-, -A-CR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>- or -A-CR<sup>3</sup>R<sup>4</sup>-CR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>- wherein A is an oxygen atom or a sulfur atom, R<sup>1</sup>-R<sup>6</sup> are the same or different, and are each a hydrogen atom, a halogen atom, hydroxy, an aliphatic hydrocarbon group which may be optionally substituted, a-O- (aliphatic hydrocarbon group which may be optionally substituted), an acyloxy, a phenoxy which may be optionally substituted, an amino group which may be optionally substituted, a sulfo group which may be optionally substituted, or an aryl which may be optionally substituted, or R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> and R<sup>4</sup> and/or R<sup>5</sup> and R<sup>6</sup> are combined together to form oxo, a methylene which may be optionally substituted, or an imino which may be optionally substituted; and

5

10

a group of the formula:

15



20

is an azacyclic group that may be optionally substituted;

provided that the smallest ring among rings constructed with B-, G<sup>1</sup> and G<sup>2</sup> is a 5- or 6-membered ring; or a salt thereof or a hydrate of them.

25

30

35

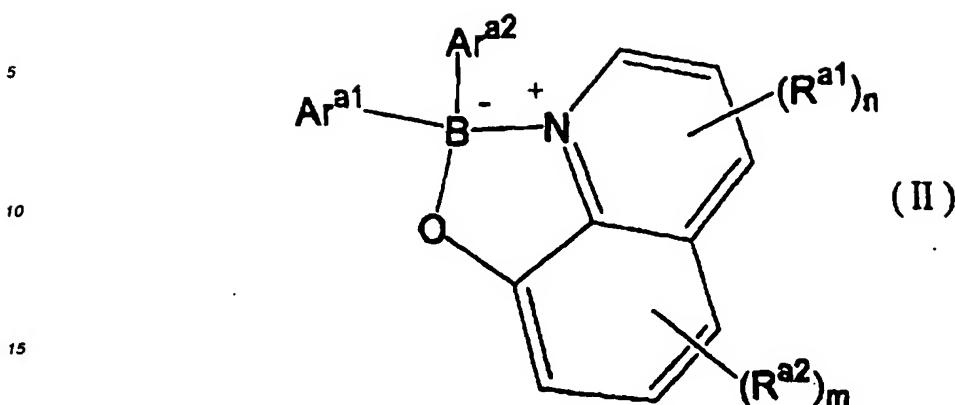
40

45

2. The pharmaceutical composition of claim 1, in which Ar<sup>1</sup> and Ar<sup>2</sup> in formula (I) are the same, and are an aryl which may be optionally substituted.
3. The pharmaceutical composition of claim 1 or 2, in which G<sup>1</sup> in formula (I) is a group of the formula: -O-, -O-CR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>- or -O-CR<sup>3</sup>R<sup>4</sup>-CR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>- wherein R<sup>1</sup>-R<sup>6</sup> are the same or different, and are each a hydrogen atom, a halogen atom, hydroxy, a lower alkyl which may be optionally substituted, a lower alkenyl which may be optionally substituted, a lower alkyloxy which may be optionally substituted, or a lower alkenyloxy which may be optionally substituted.
4. A pharmaceutical composition for use as an antiprotozoal agent, which comprises a compound of formula (I) in which all symbols are as defined in claim 1, or a salt thereof or a hydrate of them.
5. A pharmaceutical composition for use as an anticoccidial agent, which comprises a compound of formula (I) in which all symbols are as defined in claim 1, or a salt thereof or a hydrate of them.
6. A compound of formula (II):

50

55



20  
in which

Ar<sup>a1</sup> is an aryl which may be optionally substituted;

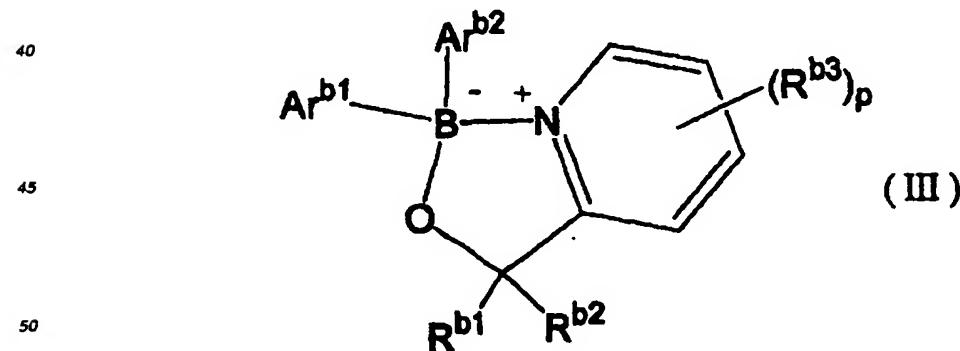
Ar<sup>a2</sup> is a fused aryl which may be optionally substituted;

25 R<sup>a1</sup> and R<sup>a2</sup> are independently a hydrogen atom, a halogen atom, a lower alkyl, a lower alkenyl, a halogenated lower alkyl, a halogenated lower alkenyl, an aralkyl which may be optionally substituted, hydroxy, a lower alkoxy, a lower alkenyloxy, a halogenated lower alkoxy, a halogenated lower alkenyloxy, an acyloxy, phenoxy which may be optionally substituted, an aralkyloxy which may be optionally substituted, an amino group which may be optionally substituted, a sulfo group which may be optionally substituted, or an aryl which may be optionally substituted; and

30 n and m are the same or different, and are an integer of 0-3;

provided that when both n and m are 0, then a compound wherein both Ar<sup>a1</sup> and Ar<sup>a2</sup> are not naphthalen-2-yl substituted at the 1-position by naphthalen-1-yl; or a salt thereof or a hydrate of them.

35 7. A compound of formula (III):



in which

55

Ar<sup>b1</sup> and Ar<sup>b2</sup> are the same or different, and are an aryl which may be optionally substituted;

R<sup>b1</sup> and R<sup>b2</sup> are independently a hydrogen atom, a halogen atom, a lower alkyl, a lower alkenyl, a halogenated lower alkyl, a halogenated lower alkenyl, an aralkyl which may be optionally substituted, hydroxy, a lower

alkoxy, a lower alkenyloxy, a halogenated lower alkoxy, a halogenated lower alkenyloxy, an acyloxy, phenoxy which may be optionally substituted, an aralkyloxy which may be optionally substituted, an amino group which may be optionally substituted, a sulfo group which may be optionally substituted, or an aryl which may be optionally substituted, or R<sup>b1</sup> and R<sup>b2</sup> are combined together to form an oxo, a methylene which may be optionally substituted or an imino which may be optionally substituted;

R<sup>b3</sup> is each a halogen atom, a lower alkyl, a lower alkenyl, a halogenated lower alkyl, a halogenated lower alkenyl, an aralkyl which may be optionally substituted, hydroxy, a lower alkoxy, a lower alkenyloxy, a halogenated lower alkoxy, a halogenated lower alkenyloxy, an acyloxy, phenoxy which may be optionally substituted, an aralkyloxy which may be optionally substituted, an amino group which may be optionally substituted, a sulfo group which may be optionally substituted, or an aryl which may be optionally substituted, or may be bonded with the adjacent group to form a fused ring; and  
p is an integer of 0-4;

provided that when p is 0, both R<sup>b1</sup> and R<sup>b2</sup> are hydrogen, and Ar<sup>b1</sup> and Ar<sup>b2</sup> is a phenyl substituted with a halogen atom or a lower alkyl, then the phenyl of Ar<sup>b1</sup> and Ar<sup>b2</sup> is additionally substituted with a substituent other than a halogen atom or a lower alkyl; or a salt thereof or a hydrate of them.

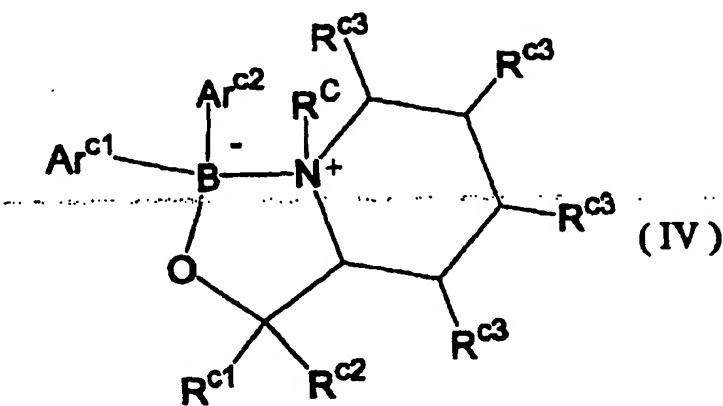
B. A compound of formula (IV):

20

25

30

35



in which

40

Ar<sup>c1</sup> and Ar<sup>c2</sup> are independently a cyclic group which may be optionally substituted;

R<sup>c1</sup> and R<sup>c2</sup> are independently a hydrogen atom, a halogen atom, a lower alkyl, a lower alkenyl, a halogenated lower alkyl, a halogenated lower alkenyl, an aralkyl which may be optionally substituted, hydroxy, a lower alkoxy, a lower alkenyloxy, a halogenated lower alkoxy, a halogenated lower alkenyloxy, an acyloxy, phenoxy which may be optionally substituted, an aralkyloxy which may be optionally substituted, an amino group which may be optionally substituted, a sulfo group which may be optionally substituted, or an aryl which may be optionally substituted, or R<sup>c1</sup> and R<sup>c2</sup> are combined together to form an oxo, a methylene which may be optionally substituted or an imino which may be optionally substituted;

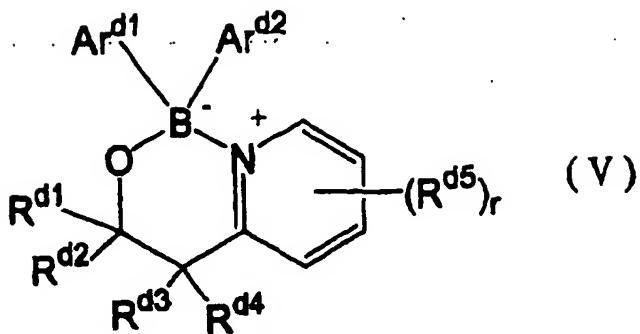
50

R<sup>c3</sup> is each a hydrogen atom, a halogen atom, a lower alkyl, a lower alkenyl, a halogenated lower alkyl, a halogenated lower alkenyl, an aralkyl which may be optionally substituted, hydroxy, a lower alkoxy, a lower alkenyloxy, a halogenated lower alkoxy, a halogenated lower alkenyloxy, an acyloxy, phenoxy which may be optionally substituted, an aralkyloxy which may be optionally substituted, an amino group which may be optionally substituted, a sulfo group which may be optionally substituted, or an aryl which may be optionally substituted, or may be combined with the adjacent group to form a fused ring; and

55

R<sup>c</sup> is a hydrogen atom or a lower alkyl; or a salt thereof or a hydrate of them.

9. A compound of formula (V):



15 in which

Ar<sup>d1</sup> and Ar<sup>d2</sup> are the same or different, and are an aryl which may be optionally substituted;  
 20 Rd<sup>d1</sup>, Rd<sup>d2</sup>, Rd<sup>d3</sup>, and Rd<sup>d4</sup> are independently a hydrogen atom, a halogen atom, a lower alkyl, a lower alkenyl, a halogenated lower alkyl, a halogenated lower alkenyl, an aralkyl which may be optionally substituted, hydroxy, a lower alkoxy, a lower alkenyloxy, a halogenated lower alkoxy, a halogenated lower alkenyloxy, an acyloxy, phenyloxy which may be optionally substituted, an aralkyloxy which may be optionally substituted, an amino group which may be optionally substituted, a sulfo group which may be optionally substituted, or an aryl which may be optionally substituted, or Rd<sup>d1</sup> and Rd<sup>d2</sup> and/or Rd<sup>d3</sup> and Rd<sup>d4</sup> are combined together to form an oxo, a methylene which may be optionally substituted or an imino which may be optionally substituted;  
 25 Rd<sup>d5</sup> is each a halogen atom, a lower alkyl, a lower alkenyl, a halogenated lower alkyl, a halogenated lower alkenyl, an aralkyl which may be optionally substituted, hydroxy, a lower alkoxy, a lower alkenyloxy, a halogenated lower alkoxy, a halogenated lower alkenyloxy, an acyloxy, phenyloxy which may be optionally substituted, an aralkyloxy which may be optionally substituted, an amino group which may be optionally substituted, a sulfo group which may be optionally substituted, or an aryl which may be optionally substituted, or may be combined with the adjacent group to form a fused ring; and  
 30 r is an integer of 0-4;

35 provided that when r is 0, all of Rd<sup>d1</sup>, Rd<sup>d2</sup>, Rd<sup>d3</sup> and Rd<sup>d4</sup> are hydrogen, and Ar<sup>d1</sup> and Ar<sup>d2</sup> are phenyl substituted with a halogen atom or a lower alkyl, then the phenyl of Ar<sup>d1</sup> and Ar<sup>d2</sup> is additionally substituted with a substituent other than a halogen atom or a lower alkyl; or a salt thereof or a hydrate of them.

- 40 10. A pharmaceutical composition useful for animals except for humans, which comprises a compound of any one of claims 6 to 9.
11. A pharmaceutical composition for use as an antiprotozoal agent, which comprises a compound of any one of claims 6 to 9.
- 45 12. A pharmaceutical composition for use as an anticoccidial agent, which comprises a compound of any one of claims 6 to 9.

50

55

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP99/07139

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER  
Int.Cl' A61K31/69, A61P33/02, C07F5/02

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)  
Int.Cl' A61K31/69, A61P33/02, C07F5/02

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)  
CAPLUS (STN) , REGISTRY (STN) , MEDLINE (STN) , EMBASE (STN)

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X Y	TRUJILLO, Jose et al. X-ray crystallographic study of boroxazolidones obtained from L-ornithine, L-methionine, kainic acid and 2,6-pyridinedicarboxylic acid, J. Organomet. Chem., 1998, Vol.571, No.1, pp.21-29, especially, page 22	7,8 1-5,10-12
X Y	HOPFL, Herbert et al, Study of cyclic borinates obtained from piperidine- and piperazine alcohols by spectroscopic methods and X-ray crystallography, J. Organomet. Chem., 1998, Vol.553, No.1-2, pp.221-239, especially, pages 222,227	8 1-5,10-12
X Y	DOROKHOV, V.A. et al, Boron chelate complexes with some enaminones and diketones containing pyridine moiety and their mutual transformation in solutions, Izv. Akad. Nauk, Ser. Khim., 1996, No.3, pp.710-714, especially, page 712	7 1-5,10-12
X Y	Yuan, Guo-Zheng et al, Single site transarylation of 2,2'-dimetalized 1,1'-binaphthyl to aminochloroborates and synthesis of 2-binaphthyl boron compounds, Youji Huaxue, 1996, Vol.16, No.2, pp.139-144, especially, pages 139,140	6 1-5,10-12

 Further documents are listed in the continuation of Box C.  See patent family annex.

* Special categories of cited documents:	
"A"	document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
"E"	earlier document but published on or after the international filing date
"L"	document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
"O"	document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
"P"	document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed
"T"	later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"X"	document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"Y"	document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"&"	document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search  
22 February, 2000 (22.02.00) Date of mailing of the international search report  
29 February, 2000 (29.02.00)Name and mailing address of the ISA/  
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP99/07139

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	US, 5348947, A (PATEL, Bomi P.), 20 September, 1994 (20.09.94) (Family: none) the whole document	7 1-5,10-12
X	US, 5348947, A (PATEL, Bomi P.), 20 September, 1994 (20.09.94) (Family: none) the whole document	7 1-5,10-12
X	TORRES, Luis Alfonso et al, Rotating-bomb combustion calorimetry and the standard enthalpies of formation of two borinic esters, J. Chem. Thermodyn. Vol.1994, No.26, No.4, pp.337-43, especially, page 338	7,9 1-5,10-12
X	PARFAN, Norberto et al, Through-bond modulation of N-fwdarw.B ring formation shown by NMR and x-ray diffraction studies of borate derivatives of pyridyl alcohols, J. Chem. Soc., Perkin Trans. 2, 1992, No.4, pp.527-32, especially, page 527	7,9 1-5,10-12
X	LIU, Xiaolan et al, Structure studies of bis(substituted)-2-(substituted)-8-hydroxyquinolines, Youji Huaxue, 1991, Vol.11, No.4, pp.410-15, especially, pages 412,414	6 1-5,10-12
X	SHAN, Zixing et al, Synthesis of aromatic nitrogen-containing heterocyclic derivatives of asymmetric diarylborinic acids, Wuhan Daxue Xuebao, Ziran Kexueban, 1990, No.3, pp.67-72, especially, page 68	6,7 1-5,10-12
X	YUAN, Guozheng et al, Ligand substitution reaction of diarylboron chelates, Wuji Huaxue Xuebao, 1990, Vol.6, No.3, pp.314-18, especially, pages 314,315	6 1-5,10-12
X	YUAN, Guozheng et al, Studies on antitumor boron compounds. V. Fluorine- and methoxy-substituted diphenylboron chelates with N,O-bidentate ligands, Youji Huaxue, 1989, Vol.9, No.3, pp.226-9, especially, page 227	6 1-5,10-12
X	YUAN, Guozheng et al, Boron compounds. XX. Synthesis and conversion of ethanolamine-tri(2-furyl)borane, Youji Huaxue 1987, No.2, pp.146-9, especially, page 148	6 1-5,10-12
X	MOEHRLE, H. et al, Concurrent reaction of the phenol and the 1,3-dicarbonyl function under Mannich conditions, Pharmazie, 1985, Vol.40, No.11, pp.767-71, especially, Page 767	6 1-5,10-12
X	MOEHRLE, H. et al, Reaction of functional epoxycarbonyl compounds opposed to hydrogen chloride, Pharmazie, 1985, Vol.40, No.6, pp.387-93, especially, page 389	6 1-5,10-12
X	MOEHRLE, H. et al, Real structures of drugs seemingly derived from -(8-hydroxyquinol-5-yl)-3-phenylpropane-1,3-dione, Pharmazie, 1985, Vol.40, No.5, pp.307-11, especially, page 309	6 1-5,10-12
X	LIN, Kai et al, Synthesis and antitumor activity of organyloxy-diarylborane chelates containing quinoline ring, Yiyao Gongye, 1985, Vol.16, No.11, pp.500-2, especially, page 501	6 1-5,10-12

Form PCT/ISA/210 (continuation of second sheet) (July 1992)

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP99/07139

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X Y	BAILEY, P.J. et al, Boron-containing antibacterial agents: effects on growth and morphology of bacteria under various culture conditions, Antimicrob. Agents Chemother., 1980, Vol.17, No.4, pp.549-53, especially, Fig.1	6 1-5,10-12
X Y	MOEHRLE, H. et al, Conformation influences during the dehydrogenation of phenolic Mannich bases, Monatsh. Chem., 1974, Vol.105, No.6, pp.1151-63, especially, page 1156	6 1-5,10-12
X Y	TITKOV, Yu.B. et al, Luminescence method for determining molybdenum with hydroxyquinoline and sodium tetraphenylborate, Ukr. Khim. Zh., 1970, Vol.36, No.6, pp.613-15, especially, page 614	6 1-5,10-12
X Y	DOUGLASS, James E. et al, Some bis-amine complexes of boronium ions with bulky substituents of boron, J. Organomet. Chem., 1967, Vol.8, No.3, pp.421-6, especially, page 421	6 1-5,10-12
X Y	DE, 1670494, A (Chemie Grünenthal GmbH), 21 January, 1971 (21.01.71) (Family: none) page 2, line 6 to page 4	1-12
X Y	EP, 969531, A2 (Bayer Aktiengesellschaft), 05 January, 2000 (05.01.00), Par. Nos. [0046] to [0079]; Claim 10 & DE, 19829947, A1	6

Form PCT/ISA/210 (continuation of second sheet) (July 1992)



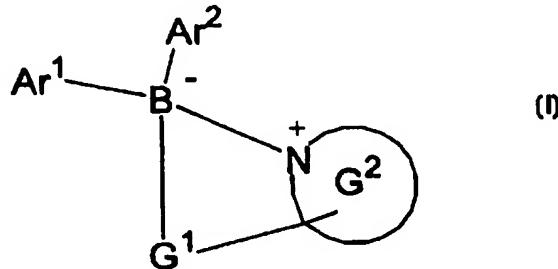
PCT

特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(51) 国際特許分類7 A61K 31/69, A61P 33/02, C07F 5/02	A1	(11) 国際公開番号 WO00/44387 (43) 国際公開日 2000年8月3日(03.08.00)
(21) 国際出願番号 PCT/JP99/07139 (22) 国際出願日 1999年12月20日(20.12.99) (30) 優先権データ 特願平11/21822 1999年1月29日(29.01.99) JP (71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 日東化成株式会社(NITTO KASEI CO., LTD.)[JP/JP] 〒533-0031 大阪府大阪市東淀川区西淡路3丁目17番14号 Osaka, (JP) 塩野義製薬株式会社(SHIONOGI & CO., LTD.)[JP/JP] 〒541-0045 大阪府大阪市中央区道修町三丁目1番8号 Osaka, (JP) (72) 発明者 ; および (75) 発明者 / 出願人 (米国についてのみ) 今崎秀之(IMAZAKI, Hideyuki)[JP/JP] 〒618-0024 大阪府三島郡島本町若山台 2丁目2番20-102 Osaka, (JP) 藤川正澄(FUJIKAWA, Masazumi)[JP/JP] 〒630-8024 奈良県奈良市尼辻中町3-11-5 Nara, (JP) 早瀬善男(HAYASE, Yoshio)[JP/JP] 〒519-0105 三重県龜山市みずほ台14-177 Mie, (JP)	川口陽資(KAWAGUCHI, Harumoto)[JP/JP] 〒519-1402 三重県阿山郡伊賀町柘植町1421 Mie, (JP) (74) 代理人 青山 康, 外(AOYAMA, Tamotsu et al.) 〒540-0001 大阪府大阪市中央区城見1丁目3番7号 IMPビル 青山特許事務所 Osaka, (JP) (81) 指定国 JP, US, 欧州特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE) 添付公開書類 国際調査報告書	

(54) Title: ORGANOBORON COMPOUNDS EXHIBITING ANTICOCCIDIAL ACTIVITIES

(54) 発明の名称 抗コクシジウム活性を有する有機ボウ素化合物

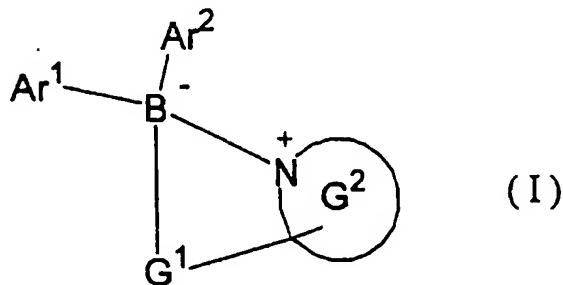


(57) Abstract

Drug compositions for animals (except *Homosapiens*), antiprotozoal agents and anticoccidial agents, containing compounds represented by general formula (I), salts of the same, or hydrates of both, wherein Ar<sup>1</sup> and Ar<sup>2</sup> are each independently an optionally substituted cyclic group; G<sup>1</sup> is -A-, -A-CR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>-, or -A-CR<sup>3</sup>R<sup>4</sup>-CR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>-; and G<sup>2</sup> is an optionally substituted azacyclic group (wherein the ring-constituting nitrogen atom is bonded to B') or the like, provided the ring composed of B', G<sup>1</sup> and G<sup>2</sup> is a five- or six-membered one.

(57)要約

本発明は一般式 (I) :



[式中、 $\text{Ar}^1$ および $\text{Ar}^2$ はそれぞれ独立して置換されていてもよい環式基；  
 $\text{G}^1$ は、式： $-\text{A}-$ 、 $-\text{A}-\text{CR}^1\text{R}^2-$ または $-\text{A}-\text{CR}^3\text{R}^4-\text{CR}^5\text{R}^6-$ で表される； $\text{G}^2$ は置換されていてもよいアザ環式基（ただし、環内窒素は $\text{B}^-$ と結合している）等；なお、 $\text{B}^-$ 、 $\text{G}^1$ および $\text{G}^2$ から構成される環は5員環または6員環である]で表わされる化合物もしくはその塩またはそれらの水和物を含有する動物（ヒトを除く）用医薬組成物、抗原虫剤、抗コクシジウム剤に関する。

PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第一頁に掲載されたPCT加盟国を同定するために使用されるコード(参考情報)

AE	アラブ首長国連邦	DM	ドミニカ	KZ	カザフスタン	RU	ロシア
AG	アンティグア・バーブーダ	DZ	アルジェリア	LC	セントルシア	SD	スードン
AL	アルバニア	EE	エストニア	LI	リヒテンシュタイン	SE	スウェーデン
AM	アルメニア	ES	スペイン	LK	スリ・ランカ	SG	シンガポール
AT	オーストリア	FI	フィンランド	LR	リベリア	SI	スロヴェニア
AU	オーストラリア	FR	フランス	LS	レソト	SK	スロヴァキア
AZ	アゼルバイジャン	GA	ガボン	LT	リトアニア	SL	シエラ・レオネ
BA	ボスニア・ヘルツェゴビナ	GB	英国	LU	ルクセンブルグ	SN	セネガル
BB	バルバドス	GD	グレナダ	LV	ラトヴィア	SZ	スワジランド
BE	ベルギー	GE	グルジア	MA	モロッコ	TD	チャード
BF	ブルガリア	GH	ガーナ	MC	モナコ	TG	トーゴー
BG	ブルガリア	GM	ガンビア	MD	モルドバ	TJ	タジキスタン
BJ	ベナン	GN	ギニア	MG	マダガスカル	TM	トルクメニスタン
BR	ブラジル	GR	ギリシャ	MK	マケドニア旧ユーゴスラヴィア	TR	トルコ
BY	ベラルーシ	GW	ギニア・ビサオ	共和国		TT	トリニダッド・トバゴ
CA	カナダ	HR	クロアチア	ML	マリ	TZ	タンザニア
CF	中央アフリカ	HU	ハンガリー	MN	モンゴル	UA	ウクライナ
CG	コンゴー	ID	インドネシア	MR	モーリタニア	UG	ウガンダ
CH	イスス	IE	アイルランド	MW	マラウイ	US	米国
CI	コートジボアール	IL	イスラエル	MX	メキシコ	UZ	ウズベキスタン
CM	カメルーン	IN	インド	MZ	モザンビーク	VN	ヴェトナム
CN	中国	IS	アイスランド	NE	ニジエール	YU	ユーゴースラヴィア
CR	コスタ・リカ	IT	イタリア	NL	オランダ	ZA	南アフリカ共和国
CU	キューバ	JP	日本	NO	ノールウェー	ZW	ジンバブエ
CY	キプロス	KE	ケニア	NZ	ニュージーランド		
CZ	チェコ	KG	キルギスタン	PL	ポーランド		
DE	ドイツ	KP	北朝鮮	PT	ポルトガル		
DK	デンマーク	KR	韓国	RO	ルーマニア		

## 明細書

## 抗コクシジウム活性を有する有機ホウ素化合物

5 発明の属する技術分野

本発明は獣医学の分野に属し、新規な動物（ヒトを除く）用医薬組成物、抗原虫剤および抗コクシジウム剤を提供する。詳細には、本発明は有機ホウ素化合物を含有する組成物およびそれらの化合物に関する。

発明の背景

10 コクシジウム症は、原生動物（Apicomplexa門胞子虫綱）の一亜綱であるコクシジア（coccidia）による感染症である。コクシジア属であるアイメリア・テネラ（*Eimeria tenella*）、アイメリア・アセルブリーナ（*Eimeria acervulina*）およびアイメリア・ネカトリックス（*Eimeria necatrix*）などが主として家禽類に感染し、消化管出血、死あるいは成長抑制などの種々の症状を引き起こす。家禽類、例えばニワトリおよびアヒル等を営業上の目的で飼育している養鶏場においてコクシジウム症が集団発生すると極めて大きな損失をもたらし、しばしば深刻な問題となっている。従って、コクシジウム症の予防および治療に有効な抗コクシジウム剤に大きな関心が寄せられている。

従来技術および発明が解決しようとする課題

20 従来、抗コクシジウム剤としてはサルファ剤、ニトロフラン剤、キノリン剤、抗チアミン剤およびベンゾアミド類等が実用に供され、現在は主としてポリエーテル系抗生物質が使用されている。例えば、サリノマイシンやクロピドールが挙げられる。しかしながら、これらは主作用である抗コクシジウム作用の強度がさほど強くない上に、宿主に対する毒性に問題がある。また、薬剤の永年使用によって薬剤耐性株が出現し、そのために薬剤の効力が漸次低下するという事態が起きている。このような事情を考慮し、耐性株に有効であると同時に耐性を与える難い新規な型の家禽用抗コクシジウム剤の開発が要望されている。

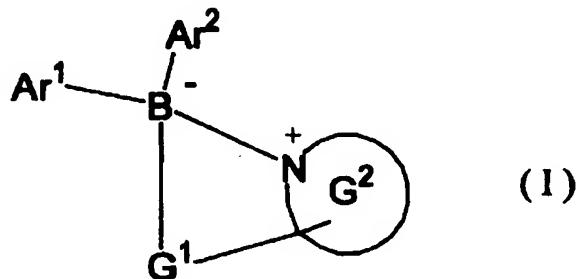
本発明者らは銳意検討した結果、上記従来技術の欠点を克服し、優れた抗コクシジウム活性を有し、かつコクシジウム症の集団発生を防止することができる有

機ホウ素化合物を見出した。

有機ホウ素化合物として、Farfan, Norbertoら、J. Chem Soc., Perkin Trans. 2 (1992), (4), 527-32にはジフェニル（2-ピリジルアルキルオキシ-O, N) ボロン類およびその製造が記載され、またVershbitskii, F. R. ら、Term. Anal. Fazovye Ravnovesiya (1985), 31-3には分子内配位した有機ホウ素化合物が記載されているが、これら化合物の用途は一切記載されていない。そして Lin, Kai ら、Yiyao Gongye (1985), 16(11), 500-2には (p-フルオロフェニル) (o-メトキシフェニル) ポリネートと 8-ヒドロキシキノリンとを反応させ対応する置換フェニルを 2 つ有するホウ素含有環状物が記載され、これは抗腫瘍活性を示すことが記載されているが、問題の抗コクシジウム作用については記載されていない。

#### 課題を解決するための手段

すなわち、本発明は、一般式 (I) :

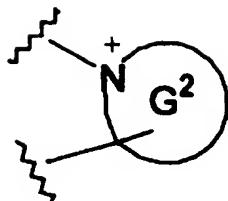


[式中、 $A r^1$  および  $A r^2$  はそれぞれ独立して、置換されていてもよい環式基；

$G^1$  は、式 :  $-A-$ 、 $-A-CR^1R^2-$  または  $-A-CR^3R^4-CR^5R^6-$  で表される基 (式中、A は酸素原子または硫黄原子、 $R^1$  ~  $R^6$  はそれぞれ同一または異なって水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、置換されていてもよい脂肪族炭化水素基、 $-O-$  (置換されていてもよい脂肪族炭化水素基)、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または  $R^1$  と  $R^2$ 、 $R^3$  と  $R^4$  および／もしくは  $R^5$  と  $R^6$  が一緒になってオキソ、置換されていてもよいメチレンもしくは置換されていてもよいイミノを形

成する) ;

式 :



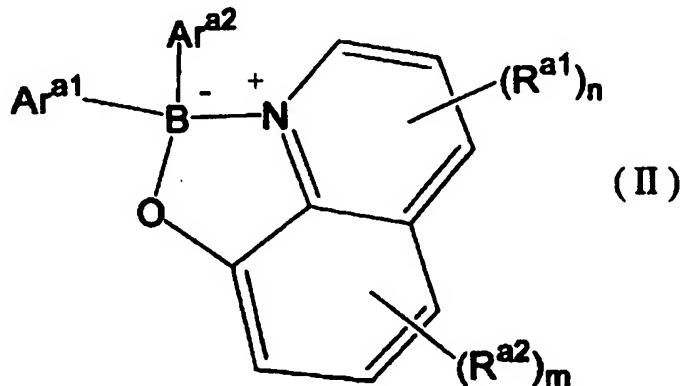
で示される基は置換されていてもよいアザ環式基；

5 ただし、B<sup>-</sup>、G<sup>1</sup>およびG<sup>2</sup>から構成される環のうち最小環は5員環または6員環であるものとする】

で表わされる化合物もしくはその塩またはそれらの水和物を含有する動物（ヒトを除く）用医薬組成物、抗原虫剤、抗コクシジウム剤に関する。

10 別の態様として、本発明は上記式(I)で示される化合物中、以下に示す化合物を包含する：

1) 一般式(II) :



[式中、Ar<sup>a1</sup>は、置換されていてもよいアリール基；

Ar<sup>a2</sup>は置換されていてもよい縮合アリール基；

15 R<sup>a1</sup>およびR<sup>a2</sup>はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシリルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換され

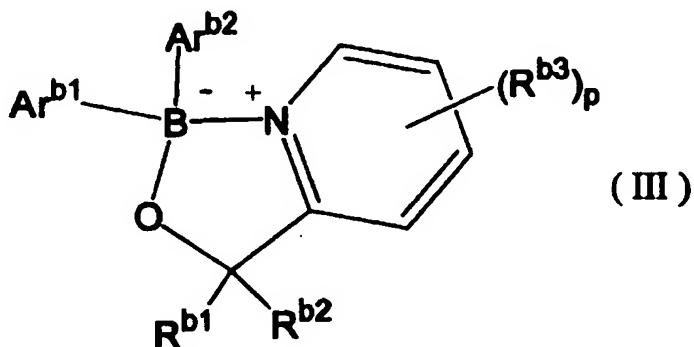
ていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、または置換されていてもよいアリール基；

$n$  および  $m$  は同一または異なって 0 ~ 3 のいずれかの整数を示す。

ただし、 $n$  および  $m$  がともに 0 であるとき、 $A_{r^{+1}}$  および  $A_{r^{+2}}$  がともに 1 位がナフタレンー 1-イルで置換されているナフタレンー 2-イルである場合を除く。]

で表わされる化合物もしくはその塩またはそれらの水和物；

2) 一般式 (III) :



[式中、 $A_{r^{+1}}$  および  $A_{r^{+2}}$  は同一または異なって置換されていてもよいアリール基；

$R^{b1}$  および  $R^{b2}$  はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシリルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または  $R^{b1}$  と  $R^{b2}$  が一緒になってオキソ、置換されていてもよいメチレンもしくは置換されていてもよいイミノを形成する；

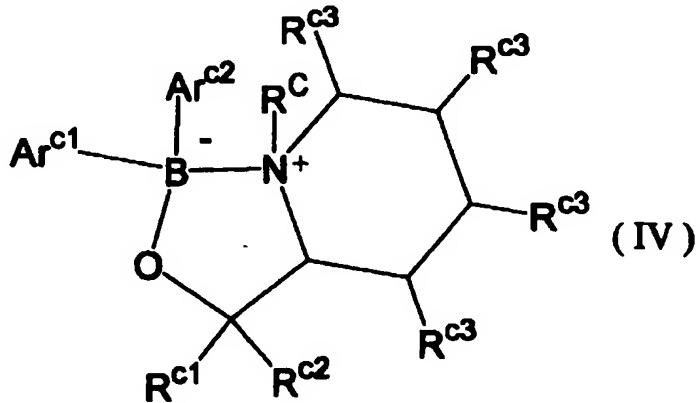
$R^{b3}$  はそれぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ

基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシリ  
オキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキ  
ルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、ま  
たは置換されていてもよいアリール基であるか、または隣接する基と一緒になつ  
て縮合環を形成していてもよい；

5 p は 0 ~ 4 のいずれかの整数を示す。

ただし、p が 0、 $R^{b1}$  および  $R^{b2}$  がともに水素ならびに  $A_r^{b1}$  および  $A_r^{b2}$   
がハロゲン原子または低級アルキル基によって置換されているフェニルであると  
き、 $A_r^{b1}$  および  $A_r^{b2}$  における該フェニルはハロゲン原子および低級アルキ  
ル基以外の置換基によってさらに置換されているものとする。]  
10 で表わされる化合物もしくはその塩またはそれらの水和物；

3) 一般式 (IV) :



[式中、 $A_r^{c1}$  および  $A_r^{c2}$  はそれぞれ独立して、置換されていてもよい環式  
15 基；

$R^{c1}$  および  $R^{c2}$  はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキ  
ル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニ  
ル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、  
低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケ  
20 ニルオキシ基、アシリルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換され  
ていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されてい  
てもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または

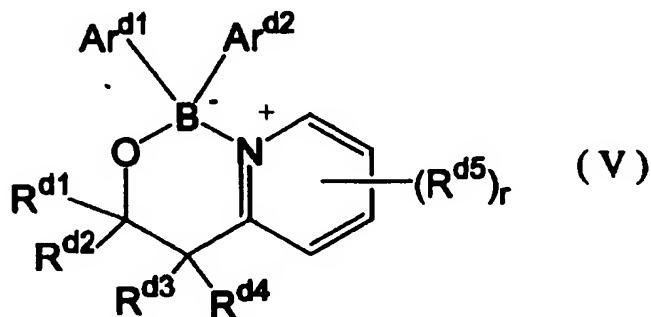
$R^{d1}$ と $R^{d2}$ が一緒になってオキソ、置換されていてもよいメチレンもしくは置換されていてもよいイミノを形成する；

$R^{d3}$ はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシリルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または隣接する基と一緒になって縮合環を形成していてもよい；

10  $R^d$ は水素原子または低級アルキルを示す]

で表わされる化合物もしくはその塩またはそれらの水和物；および

4) 一般式 (V) :



15 [式中、 $Ar^{d1}$ および $Ar^{d2}$ は同一または異なって置換されていてもよいアリール基；

$R^{d1}$ 、 $R^{d2}$ 、 $R^{d3}$ および $R^{d4}$ はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシリルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または $R^{d1}$ と $R^{d2}$ および/または $R^{d3}$ と $R^{d4}$ が一緒になってオキソ、置換され

ていてもよいメチレンもしくは置換されていてもよいイミノを形成する；

$R^{d_5}$ はそれぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシリオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または隣接する基と一緒にになって縮合環を形成していてもよい；

$r$  は 0～4 のいずれかの整数を示す。

ただし、 $r$  が 0、 $R^{d_1}$ 、 $R^{d_2}$ 、 $R^{d_3}$  および  $R^{d_4}$  がすべて水素ならびに  $A_r^{d_1}$  および  $A_r^{d_2}$  がハロゲン原子または低級アルキル基によって置換されているフェニルであるとき、 $A_r^{d_1}$  および  $A_r^{d_2}$  における該フェニルはハロゲン原子および低級アルキル基以外の置換基によってさらに置換されているものとする。] で表わされる化合物もしくはその塩またはそれらの水和物。

上記式中、 $A_r^{d_1}$  および  $A_r^{d_2}$  で示される「置換されていてもよい環式基」とは、例えば単環式または縮合多環式の脂環式炭化水素基（例、置換されていてもよいシクロアルキル基、置換されていてもよいシクロアルケニル基、置換されていてもよいシクロアルカジエニル基等）、単環式または縮合多環式の芳香族炭化水素基（例、置換されていてもよいアリール基等）、単環式または縮合多環式の複素環基（例、置換されていてもよい芳香族複素環基等）、スピロ環式の炭化水素基または複素環基等をいう。

好ましくは、 $A_r^{d_1}$  および  $A_r^{d_2}$  は同一である。

上記のシクロアルキル基の例としては、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、ビシクロ [2. 2. 1] ヘプチル、ビシクロ [2. 2. 2] オクチル、ビシクロ [3. 2. 1] オクチル、ビシクロ [3. 2. 2] ノニル、ビシクロ [3. 3. 1] ノニル、ビシクロ [4. 2. 1] ノニル、ビシクロ [4. 3. 1] デシル、アダマンチル等の炭素数 3 ないし 20 のシクロアルキル基等が挙げられる。

上記のシクロアルケニル基の例としては、例えば2-シクロ penten-1-イル、3-シクロ penten-1-イル、2-シクロ hexen-1-イル、3-シクロ hexen-1-イル等の炭素数4ないし20のシクロアルケニル基等が挙げられる。

5 上記のシクロアルカジエニル基の例としては、例えば2, 4-シクロ pentadien-1-イル、2, 4-シクロ hexadien-1-イル、2, 5-シクロ hexadien-1-イル等の炭素数4ないし20のシクロアルカジエニル基等が挙げられる。

10 上記の「アリール基」としては、例えばフェニル、インデニル、ナフチル(1-ナフチル、2-ナフチル等)、アントリル、フェナントリル、アセナフチレン、フルオレニル(9-フルオレニル、1-フルオレニル等)等の炭素数6ないし20のアリール基等が挙げられる。

15 上記の「複素環基」としては、環系を構成する原子として酸素、硫黄、窒素の少なくとも1個のヘテロ原子を含有する複素環基を意味し、単環式複素環基または縮合多環式複素環基が挙げられる。

20 単環式複素環基の具体例としては、例えばイソオキサゾリル、イソチアゾリル、イミダゾリル、1, 2, 3-オキサジアゾリル、1, 3, 4-オキサジアゾリル、オキサゾリル、フラザニル、1, 2, 3-チアジアゾリル、1, 2, 4-チアジアゾリル、1, 3, 4-チアジアゾリル、チアゾリル、チエニル、テトラゾリル、トリアジニル、1, 2, 3-トリアゾリル、1, 2, 4-トリアゾリル、ピラニル、ピラジニル、ピラゾリル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピロリル、2H-ピロリル、フラザニル、フリル等が挙げられる。

25 縮合多環式複素環基の具体例としては、例えばアクリジニル、5-アザベンゾ[a]アントラセニル、イソインドリル、イソキノリル、イソクロマニル、イソベンゾフラニル、イミダゾ[2, 1-b]チアゾリル、4H-イミダゾ[4, 5-d]チアゾリル、イミダゾ[1, 2-b][1, 2, 4]トリアジニル、イミダゾ[1, 2-a]ピリジル、イミダゾ[1, 5-a]ピリジル、イミダゾ[1, 2-b]ピリダジニル、イミダゾ[1, 2-a]ピリミジニル、イミダゾリジニル、イミダゾリニル、1H-インダゾリル、インドリジニル、インドリル、4H

[1, 3] -オキサチオロ [5, 4-b] ピロリル、1H-2-オキサピレニル、カルバゾリル、 $\alpha$ -カルボリニル、 $\beta$ -カルボリニル、 $\gamma$ -カルボリニル、キナゾリニル、キノキサリニル、キノリル、クロマニル、4H-1, 3-ジオキソロ[4, 5-b]イミダゾリル、シクロペンタ[b]ピラニル、2, 3-ジチア-1, 5-ジアザインダニル、4H-1, 3-ジチアナフタレニル、1, 4-ジチアナフタレニル、シンノニル、チアントレニル、チエノ[2, 3-b]フラニル、2, 7, 9-トリアザフェナントレニル、1, 2, 4-トリアゾロ[4, 3-a]ピリダジニル、1, 2, 4-トリアゾロ[4, 3-a]ピリジル、2, 4, 6-トリチア-3a, 7a-ジアザインダニル-ナフチリジニル、ピペラジニル、ピペリジル、ピラゾリジニル、7H-ピラジノ[2, 3-c]カルバゾリル、ピラジノ[2, 3-d]ピリダジニル、1H-ピラゾロ[4, 3-d]オキサゾリル、ピラゾロ[1, 5-a]ピリジル、ピリド[1', 2': 1, 2]イミダゾ[4, 5-b]キノキサリニル、5H-ピリド[2, 3-d]-o-オキサジニル、4H-ピリド[2, 3-c]カルバゾリル、ピロリジニル、ピロリニル、1H-ピロロ[1, 2-b][2]ベンゾアゼビニル、ピロロ[1, 2-b]ピリダジニル、フェナジニル、フェナトリジニル、フェナトロリニル、フェノキサジニル、フェノキサチイニル、フェノチアジニル、フタラジニル、ブテリジニル、ブリニル、2H-フロ[3, 2-b]ピラニル、フロ[3, 4-c]シンシノリニル、1, 2-ベンゾイソオキサゾリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾオキサゾリル、4H-3, 1-ベンゾオキサジニル、3-ベンゾオキセビニル、ベンゾチアゾリル、ベンゾ[b]チエニル、1H-ベンゾトリアゾリル、ベンゾ[b]フラニル、モルホリニル、等が挙げられる。

A<sub>r</sub><sup>1</sup>およびA<sub>r</sub><sup>2</sup>で示される「置換されていてもよい環式基」として好ましい基は置換されていてもよいアリール基であり、詳細には例えば、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ヒドロキシ基、アシリル基、アミノ基等によって置換されていてもよいアリール基が挙げられる。なお、A<sub>r</sub><sup>1</sup>およびA<sub>r</sub><sup>2</sup>におけるアリール基または複素環基の置換基の数

は1つに限定されず、またその種類も1つに限定されない。

以下、置換されていてもよいアリール基のうち置換基の種類がひとつである場合について主な具体例を列挙する。

「ハロゲン原子」とは、例えばフッ素、塩素、臭素等を表す。

よって、上記のハロゲン原子で置換されたアリール基としては、例えば2-ハロゲン化フェニル（例、2-フロロフェニル、2-クロロフェニル、2-ブロモフェニル等）、3-ハロゲン化フェニル（例、3-フロロフェニル、3-クロロフェニル、3-ブロモフェニル等）、4-ハロゲン化フェニル（例、4-フロロフェニル、4-クロロフェニル、4-ブロモフェニル等）、2-ハロゲン化ナフタレン-1-イル（例、2-フロロナフタレン-1-イル、2-クロロナフタレン-1-イル、2-ブロモナフタレン-1-イル等）、3-ハロゲン化ナフタレン-1-イル（例、3-フロロナフタレン-1-イル、3-クロロナフタレン-1-イル、3-ブロモナフタレン-1-イル等）、4-ハロゲン化ナフタレン-1-イル（例、4-フロロナフタレン-1-イル、4-クロロナフタレン-1-イル、4-ブロモナフタレン-1-イル等）、5-ハロゲン化ナフタレン-1-イル（例、5-フロロナフタレン-1-イル、5-クロロナフタレン-1-イル、5-ブロモナフタレン-1-イル等）、6-ハロゲン化ナフタレン-1-イル（例、6-フロロナフタレン-1-イル、6-クロロナフタレン-1-イル、6-ブロモナフタレン-1-イル等）、7-ハロゲン化ナフタレン-1-イル（例、7-フロロナフタレン-1-イル、7-クロロナフタレン-1-イル、7-ブロモナフタレン-1-イル等）、8-ハロゲン化ナフタレン-1-イル（例、8-フロロナフタレン-1-イル、8-クロロナフタレン-1-イル、8-ブロモナフタレン-1-イル等）、1-ハロゲン化ナフタレン-2-イル（例、1-フロロナフタレン-2-イル、1-クロロナフタレン-2-イル、1-ブロモナフタレン-2-イル等）、3-ハロゲン化ナフタレン-2-イル（例、3-フロロナフタレン-2-イル、3-クロロナフタレン-2-イル、3-ブロモナフタレン-2-イル等）、4-ハロゲン化ナフタレン-2-イル（例、4-フロロナフタレン-2-イル、4-クロロナフタレン-2-イル、4-ブロモナフタレン-2-イル等）、5-ハロゲン化ナフタレン-2-イル（例、5-フロロナフタレン-2-イル等）。

—2—イル、5—クロロナフタレン—2—イル、5—プロモナフタレン—2—イル等)、6—ハロゲン化ナフタレン—2—イル(例、6—フロロナフタレン—2—イル、6—クロロナフタレン—2—イル、6—プロモナフタレン—2—イル等)、7—ハロゲン化ナフタレン—2—イル(例、7—フロロナフタレン—2—イル、7—クロロナフタレン—2—イル、7—プロモナフタレン—2—イル等)、8—ハロゲン化ナフタレン—2—イル(例、8—フロロナフタレン—2—イル、8—クロロナフタレン—2—イル、8—プロモナフタレン—2—イル等)、2—ハロゲン化インデン—1—イル(例、2—フロロインデン—1—イル、2—クロロインデン—1—イル、2—プロモインデン—1—イル等)、3—ハロゲン化インデン—1—イル(例、3—フロロインデン—1—イル、3—クロロインデン—1—イル、3—プロモインデン—1—イル等)、4—ハロゲン化インデン—1—イル(例、4—フロロインデン—1—イル、4—クロロインデン—1—イル、4—プロモインデン—1—イル等)、5—ハロゲン化インデン—1—イル(例、5—フロロインデン—1—イル、5—クロロインデン—1—イル、5—プロモインデン—1—イル等)、6—ハロゲン化インデン—1—イル(例、6—フロロインデン—1—イル、6—クロロインデン—1—イル、6—プロモインデン—1—イル等)、7—ハロゲン化インデン—1—イル(例、7—フロロインデン—1—イル、7—クロロインデン—1—イル、7—プロモインデン—1—イル等)、1—ハロゲン化インデン—2—イル(例、1—フロロインデン—2—イル、1—クロロインデン—2—イル、1—プロモインデン—2—イル等)、3—ハロゲン化インデン—2—イル(例、3—フロロインデン—2—イル、3—クロロインデン—2—イル、3—プロモインデン—2—イル等)、4—ハロゲン化インデン—2—イル(例、4—フロロインデン—2—イル、4—クロロインデン—2—イル、4—プロモインデン—2—イル等)、5—ハロゲン化インデン—2—イル(例、5—フロロインデン—2—イル、5—クロロインデン—2—イル、5—プロモインデン—2—イル等)、6—ハロゲン化インデン—2—イル(例、6—フロロインデン—2—イル、6—クロロインデン—2—イル、6—プロモインデン—2—イル等)、7—ハロゲン化インデン—2—イル(例、7—フロロインデン—2—イル、7—クロロインデン—2—イル、7—プロモインデン—2—イル等)、7—ハロ

ゲン化インデン-4-イル（例、7-フロロインデン-4-イル、7-クロロインデン-4-イル、7-ブロモインデン-4-イル等）、5-ハロゲン化インデン-3-イル（例、5-フロロインデン-3-イル、5-クロロインデン-3-イル、5-ブロモインデン-3-イル等）、3-ハロゲン化インデン-5-イル（例、3-フロロインデン-5-イル、3-クロロインデン-5-イル、3-ブロモインデン-5-イル等）、2-ハロゲン化インデン-6-イル（例、2-フロロインデン-6-イル、2-クロロインデン-6-イル、2-ブロモインデン-6-イル等）、4-ハロゲン化インデン-7-イル（例、4-フロロインデン-7-イル、4-クロロインデン-7-イル、4-ブロモインデン-7-イル等）、1-ハロゲン化インデン-4-イル（例、1-フロロインデン-4-イル、1-クロロインデン-4-イル、1-ブロモインデン-4-イル等）、2, 3-ジハロゲン化フェニル（例、2, 3-ジフルオロフェニル、2, 3-ジクロロフェニル、2, 3-ジブロモフェニル等）、2, 3-ジハロゲン化ナフタレン-1-イル（例、2, 3-ジフルオロナフタレン-1-イル、2, 3-ジクロロナフタレン-1-イル、2, 3-ジブロモナフタレン-1-イル等）、2, 4-ジハロゲン化フェニル（例、2, 4-ジフルオロフェニル、2, 4-ジクロロフェニル、2, 4-ジブロモフェニル等）、2, 6-ジハロゲン化フェニル（例、2, 6-ジフルオロフェニル、2, 6-ジクロロフェニル、2, 6-ジブロモフェニル等）、4, 5-ジハロゲン化ナフタレン-1-イル（例、4, 5-ジフルオロナフタレン-1-イル、4, 5-ジクロロナフタレン-1-イル、4, 5-ジブロモナフタレン-1-イル等）、4, 6-ジハロゲン化ナフタレン-1-イル（例、4, 6-ジフルオロナフタレン-1-イル、4, 6-ジクロロナフタレン-1-イル、4, 6-ジブロモナフタレン-1-イル等）、4, 8-ジハロゲン化ナフタレン-1-イル（例、4, 8-ジフルオロナフタレン-1-イル、4, 8-ジクロロナフタレン-1-イル、4, 8-ジブロモナフタレン-1-イル等）等が挙げられる。このように、それぞれの置換位置としては、フェニル基であれば、2-、3-、4-が、ナフタレン-1-イルであれば、2-、3-、4-、5-、6-、7-、8-があり特に限定されない。

上記の「低級アルキル」としては、例えばメチル、エチル、プロピル、イソブ

ロピル、ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、ペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、tert-ペンチル、1-エチルプロピル、ヘキシル等の直鎖状または分枝状の炭素数1ないし10のアルキル基等が挙げられる。

なお、本明細書中、「低級」なる用語は、別に定めのない限り、アルキル基、  
5 アルケニル基等の脂肪族炭化水素基中の炭素原子数が1～10、好ましくは1～  
8、さらに好ましくは1～6を示すものとする。

よって、上記の低級アルキルで置換されたアリール基としては、例えば2-メチルフェニル、3-メチルフェニル、4-メチルフェニル、2-エチルフェニル、  
10 3-エチルフェニル、4-エチルフェニル、2-メチルナフタレン-1-イル、  
3-メチルナフタレン-1-イル、4-メチルナフタレン-1-イル、5-メチルナフタレン-1-イル、6-メチルナフタレン-1-イル、7-メチルナフタレン-1-イル、  
15 8-メチルナフタレン-1-イル、2, 4-ジメチルフェニル、2, 4, 6-トリメチルフェニル、4, 5-ジメチルナフタレン-1-イル、4, 6-ジメチルナフタレン-1-イル、  
2-メチルインデン-1-イル、3-メチルインデン-1-イル、4-メチルインデン-1-イル、5-メチルインデン-1-イル、6-メチルインデン-1-イル、  
20 7-メチルインデン-1-イル、1-メチルインデン-2-イル、3-メチルインデン-2-イル、4-メチルインデン-2-イル、5-メチルインデン-2-イル、  
6-メチルインデン-2-イル、7-メチルインデン-2-イル、1-メチルインデン-3-イル、2-メチルインデン-3-イル、4-メチルインデン-3-イル、  
5-メチルインデン-3-イル、6-メチルインデン-3-イル、7-メチルインデン-3-イル、1-メチルインデン-4-イル、2-メチルインデン-4-イル、  
25 3-メチルインデン-4-イル、5-メチルインデン-4-イル、7-メチルインデン-4-イル、1-メチルインデン-5-イル、2-メチルインデン-5-イル、  
3-メチルインデン-5-イル、4-メチルインデン-5-イル、6-メチルインデン-5-イル、7-メチルインデン-5-イル、1-メチルインデン-6-イル、2-メチルインデン-6-イル、  
3-メチルインデン-6-イル、4-メチルインデン-6-イル、6-メチルインデン-6-イル、7-メチルインデン-6-イル、

1-メチルインデン-7-イル、2-メチルインデン-7-イル、3-メチルインデン-7-イル、4-メチルインデン-7-イル、5-メチルインデン-7-イル、6-メチルインデン-7-イル等が挙げられる。それぞれの置換位置としては、フェニル基であれば、2-、3-、4-が、ナフタレン-1-イルであれば、2-、3-、4-、5-、6-、7-、8-があり特に限定されない。

上記の「低級アルケニル基」としては、例えばビニル、アリル、イソプロペニル、1-プロペニル、2-メチル-1-プロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、2-エチル-1-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、4-メチル-3-ペンテニル等の直鎖状または分枝状の炭素数1ないし10のアルケニル基が挙げられる。

よって、上記の低級アルケニルで置換されたアリール基としては、例えば、2-ビニルフェニル、3-ビニルフェニル、4-ビニルフェニル、2-アリルフェニル、3-アリルフェニル、4-アリルフェニル、2-ビニルナフタレン-1-イル、3-ビニルナフタレン-1-イル、4-ビニルナフタレン-1-イル、5-ビニルナフタレン-1-イル、6-ビニルナフタレン-1-イル、7-ビニルナフタレン-1-イル、8-ビニルナフタレン-1-イル、2-ビニルインデン-1-イル、3-ビニルインデン-1-イル、4-ビニルインデン-1-イル、5-ビニルインデン-1-イル、6-ビニルインデン-1-イル、7-ビニルインデン-1-イル、1-ビニルインデン-2-イル、3-ビニルインデン-2-イル、4-ビニルインデン-2-イル、5-ビニルインデン-2-イル、7-ビニルインデン-2-イル、1-ビニルインデン-3-イル、2-ビニルインデン-3-イル、4-ビニルインデン-3-イル、5-ビニルインデン-3-イル、6-ビニルインデン-3-イル、7-ビニルインデン-3-イル、1-ビニルインデン-4-イル、2-ビニルインデン-4-イル、3-ビニルインデン-4-イル、5-ビニルインデン-4-イル、6-ビニルインデン-4-イル、7-ビニルインデン-4-イル、1-ビニルインデン-5-イル、2-ビニルインデン-5-イル、3-ビニルインデン-5-イル、4-ビニルインデン-5-イル、6-ビニルインデン-5-イル、7-ビニルインデン-5-イル、

シデン-5-イル、1-ビニルインデン-6-イル、2-ビニルインデン-6-イル、3-ビニルインデン-6-イル、4-ビニルインデン-6-イル、5-ビニルインデン-6-イル、7-ビニルインデン-6-イル、1-ビニルインデン-7-イル、2-ビニルインデン-7-イル、3-ビニルインデン-7-イル、4-ビニルインデン-7-イル、5-ビニルインデン-7-イル、6-ビニルインデン-7-イル等が挙げられるが、これらに限定されない。

上記の「低級アルコキシ基」としては、例えばメトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、イソブトキシ、ネオブトキシ、t-ブトキシ、ペントキシ、イソペントキシ等の炭素数1ないし10のアルコキシ基が挙げられる。

よって、上記の低級アルコキシ基で置換されたアリール基としては、例えば2-メトキシフェニル、3-メトキシフェニル、4-メトキシフェニル、2-エトキシフェニル、3-エトキシフェニル、4-エトキシフェニル、2-メトキシナフタレン-1-イル、3-メトキシナフタレン-1-イル、4-メトキシナフタレン-1-イル、5-メトキシナフタレン-1-イル、6-メトキシナフタレン-1-イル、7-メトキシナフタレン-1-イル、8-メトキシナフタレン-1-イル、2, 4-ジメトキシフェニル、2, 4, 6-トリメトキシフェニル、4, 5-ジメトキシナフタレン-1-イル、4, 6-ジメトキシナフタレン-1-イル、4, 8-ジメトキシナフタレン-1-イル、1-メトキシインデン-2-イル、1-メトキシインデン-3-イル、1-メトキシインデン-4-イル、1-メトキシインデン-5-イル、1-メトキシインデン-6-イル、1-メトキシインデン-7-イル、1, 3-ジメトキシインデン-2-イル、1, 2-ジメトキシインデン-3-イル、1, 3-ジメトキシインデン-4-イル、2, 3-ジメトキシインデン-5-イル、1, 4-ジメトキシインデン-6-イル、1, 4-ジメトキシインデン-7-イル等が挙げられる。

上記の「ハロゲン化低級アルキル」としては、例えばフルオロメチル、クロロメチル、ブロモメチル、2-フルオロエチル、2-クロロエチル、2-ブロモエチル、1-フルオロエチル、1-クロロエチル、1-ブロモエチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、トリブロモメチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、ジブロモメチル、1, 2-ジフルオロエチル、1, 2-ジクロロエチル、

1, 2-ジプロモエチル、1, 1-ジフルオロエチル、1, 1-ジクロロエチル、  
1, 1-ジプロモエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2-ジクロロエチル、  
2, 2-ジプロモエチル等の、ハロゲンで置換された前記定義の低級アルキル基  
が挙げられる。

よって、上記のハロゲン化低級アルキル基で置換されたアリール基としては、  
例えばハロメチルで置換されたアリール基（例、フルオロメチルで置換されたフ  
ェニル基、フルオロメチルで置換されたナフタレン-1-イル、クロロメチルで  
置換されたフェニル基、クロロメチルで置換されたナフタレン-1-イル、プロ  
モメチルで置換されたフェニル基、プロモメチルで置換されたナフタレン-1-  
イル等）、2-ハロエチルで置換されたアリール基（例、2-フルオロエチルで  
置換されたフェニル基、2-フルオロエチルで置換されたナフタレン-1-イル、  
2-クロロエチルで置換されたフェニル基、2-クロロエチルで置換されたナフ  
タレン-1-イル、2-プロモエチルで置換されたフェニル基、2-プロモエチ  
ルで置換されたナフタレン-1-イル等）、1-ハロエチルで置換されたアリー  
ル基（例、1-フルオロエチルで置換されたフェニル基、1-フルオロエチルで  
置換されたナフタレン-1-イル、1-クロロエチルで置換されたフェニル基、  
1-クロロエチルで置換されたナフタレン-1-イル、1-プロモエチルで置換  
されたフェニル基、1-プロモエチルで置換されたナフタレン-1-イル等）、  
トリハロメチルで置換されたアリール基（例、トリフルオロメチルで置換された  
フェニル基、トリフルオロメチルで置換されたナフタレン-1-イル、トリクロ  
ロメチルで置換されたフェニル基、トリクロロメチルで置換されたナフタレン-  
1-イル、トリプロモメチルで置換されたフェニル基、トリプロモメチルで置換  
されたナフタレン-1-イル等）等が挙げられる。それぞれの置換位置としては、  
フェニル基であれば、2-、3-、4-が、ナフタレン-1-イルであれば、2-  
1-、3-、4-、5-、6-、7-、8-があり特に限定されない。

インデニルであれば、例えば1-フルオロメチルインデン-2-イル、1-ク  
ロロメチルインデン-2-イル、1-プロモメチルインデン-2-イル、1-  
(2-フルオロエチル) インデン-2-イル、1- (2-クロロエチル) インデ  
ン-2-イル、1- (2-プロモエチル) インデン-2-イル、1- (1-フル

オロエチル) インデン-2-イル、1-(1-クロロエチル) インデン-2-イル、1-(1-ブロモエチル) インデン-2-イル、1-トリフルオロメチルインデン-2-イル、1-トリクロロメチルインデン-2-イル、1-フルオロメチルインデン-3-イル、1-クロロメチルインデン-3-イル、1-ブロモメチルインデン-3-イル、1-(2-フルオロエチル) インデン-3-イル、1-(2-クロロエチル) インデン-3-イル、1-(1-フルオロエチル) インデン-3-イル、1-(1-クロロエチル) インデン-3-イル、1-(1-ブロモエチル) インデン-3-イル、1-トリフルオロメチルインデン-3-イル、1-トリクロロメチルインデン-3-イル、1-フルオロメチルインデン-4-イル、1-クロロメチルインデン-4-イル、1-ブロモメチルインデン-4-イル、1-(2-フルオロエチル) インデン-4-イル、1-(2-クロロエチル) インデン-4-イル、1-(2-ブロモエチル) インデン-4-イル、1-(1-フルオロエチル) インデン-4-イル、1-(1-クロロエチル) インデン-4-イル、1-(1-ブロモエチル) インデン-4-イル、1-トリフルオロメチルインデン-4-イル、1-トリクロロメチルインデン-4-イル、1-フルオロメチルインデン-5-イル、1-クロロメチルインデン-5-イル、1-ブロモメチルインデン-5-イル、1-(2-フルオロエチル) インデン-5-イル、1-(2-クロロエチル) インデン-5-イル、1-(2-ブロモエチル) インデン-5-イル、1-(1-フルオロエチル) インデン-5-イル、1-(1-クロロエチル) インデン-5-イル、1-(1-ブロモエチル) インデン-5-イル、1-トリフルオロメチルインデン-5-イル、1-トリクロロメチルインデン-5-イル、1-フルオロメチルインデン-6-イル、1-クロロメチルインデン-6-イル、1-ブロモメチルインデン-6-イル、1-(2-フルオロエチル) インデン-6-イル、1-(2-クロロエチル) インデン-6-イル、1-(2-ブロモエチル) インデン-6-イル、1-(1-フルオロエチル) インデン-6-イル、1-(1-クロロエチル) インデン-6-イル、1-(1-ブロモエチル)

モエチル) インデン-6-イル、1-トリフルオロメチルインデン-6-イル、  
1-トリクロロメチルインデン-6-イル、1-トリプロモメチルインデン-6  
-イル、1-フルオロメチルインデン-7-イル、1-クロロメチルインデン-  
7-イル、1-プロモメチルインデン-7-イル、1-(2-フルオロエチル)  
5 インデン-7-イル、1-(2-クロロエチル) インデン-7-イル、1-(2  
-プロモエチル) インデン-7-イル、1-(1-フルオロエチル) インデン-  
7-イル、1-(1-クロロエチル) インデン-7-イル、1-(1-プロモエ  
チル) インデン-7-イル、1-トリフルオロメチルインデン-7-イル、1-  
トリクロロメチルインデン-7-イル、1-トリプロモメチルインデン-7-イ  
ル等が挙げられが、これらに限定されない。

10 上記の「ハロゲン化低級アルケニル基」としては、例えば3-フルオロー-1-  
プロペニル、3-クロロー-1-プロペニル、3-プロモ-1-プロペニル、4-  
フルオロー-2-ブテニル、4-クロロー-2-ブテニル、4-プロモ-2-ブテニ  
ル、1-フルオロー-2-ブテニル、1-クロロー-2-ブテニル、1-プロモ-2  
15 -ブテニル等の、ハロゲンで置換された前記定義の低級アルケニル基が挙げられ  
る。

20 よって、上記のハロゲン化低級アルケニル基で置換されたアリール基としては、  
例えば3-ハロー-1-プロペニルで置換されたアリール基（例、3-フルオロー-  
1-プロペニルで置換されたフェニル基、3-フルオロー-1-プロペニルで置換  
されたナフタレン-1-イル、3-クロロー-1-プロペニルで置換されたフェニ  
ル基、3-クロロー-1-プロペニルで置換されたナフタレン-1-イル、3-ブ  
25 ロモ-1-プロペニルで置換されたフェニル基、3-プロモ-1-プロペニルで  
置換されたナフタレン-1-イル等）、4-ハロー-2-ブテニルで置換されたア  
リール基（例、4-フルオロー-2-ブテニルで置換されたフェニル基、4-フル  
オロー-2-ブテニルで置換されたナフタレン-1-イル、4-クロロー-2-ブテ  
ニルで置換されたフェニル基、4-クロロー-2-ブテニルで置換されたナフタレ  
ン-1-イル、4-プロモ-2-ブテニルで置換されたフェニル基、4-プロモ-  
26 -ブテニルで置換されたナフタレン-1-イル等）、1-ハロー-2-ブテニ  
ルで置換されたアリール基（例、1-フルオロー-2-ブテニルで置換されたフェ

ニル基、1-フルオロー-2-ブテニルで置換されたナフタレン-1-イル、1-クロロー-2-ブテニルで置換されたフェニル基、1-クロロー-2-ブテニルで置換されたナフタレン-1-イル、1-ブロモ-2-ブテニルで置換されたフェニル基、1-ブロモ-2-ブテニルで置換されたナフタレン-1-イル等)等が挙げられる。それぞれの置換位置としては、フェニル基であれば、2-、3-、4-が、ナフタレン-1-イルであれば、2-、3-、4-、5-、6-、7-、8-があり特に限定されない。インデニルであれば、例えば、1-(3-フルオロー-1-プロペニル)インデン-2-イル、1-(3-クロロー-1-プロペニル)インデン-2-イル、1-(3-ブロモ-1-プロペニル)インデン-2-イル、1-(4-フルオロー-2-ブテニル)インデン-2-イル、1-(4-クロロー-2-ブテニル)インデン-2-イル、1-(4-ブロモ-2-ブテニル)インデン-2-イル、1-(1-フルオロー-2-ブテニル)インデン-2-イル、1-(1-ブロモ-2-ブテニル)インデン-2-イル、1-(3-フルオロー-1-プロペニル)インデン-3-イル、1-(3-ブロモ-1-プロペニル)インデン-3-イル、1-(4-フルオロー-2-ブテニル)インデン-3-イル、1-(4-クロロー-2-ブテニル)インデン-3-イル、1-(4-ブロモ-2-ブテニル)インデン-3-イル、1-(1-フルオロー-2-ブテニル)インデン-3-イル、1-(1-クロロー-2-ブテニル)インデン-3-イル、1-(1-ブロモ-2-ブテニル)インデン-3-イル、1-(3-フルオロー-1-プロペニル)インデン-4-イル、1-(3-クロロー-1-プロペニル)インデン-4-イル、1-(3-ブロモ-1-プロペニル)インデン-4-イル、1-(4-フルオロー-2-ブテニル)インデン-4-イル、1-(4-クロロー-2-ブテニル)インデン-4-イル、1-(1-フルオロー-2-ブテニル)インデン-4-イル、1-(1-クロロー-2-ブテニル)インデン-4-イル、1-(1-ブロモ-2-ブテニル)インデン-4-イル、1-(3-フルオロー-1-プロペニル)インデン-5-イル、1-(3-クロロー-1-プロペニル)インデン-5-イル、1-(3-ブロモ-1-プロペニル)インデン-

5-イル、1-(4-フルオロ-2-ブテニル)インデン-5-イル、1-(4-クロロ-2-ブテニル)インデン-5-イル、1-(4-ブロモ-2-ブテニル)インデン-5-イル、1-(1-フルオロ-2-ブテニル)インデン-5-イル、1-(1-クロロ-2-ブテニル)インデン-5-イル、1-(1-ブロモ-2-ブテニル)インデン-5-イル、1-(3-フルオロ-1-プロペニル)インデン-6-イル、1-(3-クロロ-1-プロペニル)インデン-6-イル、1-(3-ブロモ-1-プロペニル)インデン-6-イル、1-(4-フルオロ-2-ブテニル)インデン-6-イル、1-(4-クロロ-2-ブテニル)インデン-6-イル、1-(4-ブロモ-2-ブテニル)インデン-6-イル、1-(1-フルオロ-2-ブテニル)インデン-6-イル、1-(1-クロロ-2-ブテニル)インデン-6-イル、1-(1-ブロモ-2-ブテニル)インデン-6-イル、1-(3-フルオロ-1-プロペニル)インデン-7-イル、1-(3-クロロ-1-プロペニル)インデン-7-イル、1-(3-ブロモ-1-プロペニル)インデン-7-イル、1-(4-フルオロ-2-ブテニル)インデン-7-イル、1-(4-クロロ-2-ブテニル)インデン-7-イル、1-(4-ブロモ-2-ブテニル)インデン-7-イル、1-(1-フルオロ-2-ブテニル)インデン-7-イル、1-(1-クロロ-2-ブテニル)インデン-7-イル、1-(1-ブロモ-2-ブテニル)インデン-7-イル等が挙げられるが、これらに限定されない。

上記の「ハロゲン化低級アルコキシ基」としては、例えばフルオロメトキシ、クロロメトキシ、ブロモメトキシ、1-フルオロエトキシ、1-クロロエトキシ、1-ブロモエトキシ、2-フルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、2-ブロモエトキシ等の、ハロゲンで置換された前記定義の低級アルコキシ基等が挙げられる。

よって、上記のハロゲン化低級アルコキシ基で置換されたアリール基としては、例えばハロメトキシで置換されたアリール基（例、フルオロメトキシで置換されたフェニル基、フルオロメトキシで置換されたナフタレン-1-イル、クロロメトキシで置換されたフェニル基、クロロメトキシで置換されたナフタレン-1-イル、ブロモメトキシで置換されたフェニル基、ブロモメトキシで置換されたナ

フタレン-1-イル等)、ハロエトキシで置換されたアリール基(例、1-フルオロエトキシで置換されたフェニル基、1-フルオロエトキシで置換されたナフタレン-1-イル、1-クロロエトキシで置換されたフェニル基、1-クロロエトキシで置換されたナフタレン-1-イル、1-ブロモエトキシで置換されたフェニル基、1-ブロモエトキシで置換されたナフタレン-1-イル、2-フルオロエトキシで置換されたフェニル基、2-フルオロエトキシで置換されたナフタレン-1-イル、2-クロロエトキシで置換されたフェニル基、2-クロロエトキシで置換されたナフタレン-1-イル等)等が挙げられる。それぞれの置換位置としては、フェニル基であれば、2-、3-、4-が、ナフタレン-1-イルであれば、2-、3-、4-、5-、6-、7-、8-があり特に限定されない。インデニルであれば、例えば、1-フルオロメトキシインデン-2-イル、1-クロロメトキシインデン-2-イル、1-ブロモメトキシインデン-2-イル、1-(1-フルオロエトキシ)インデン-2-イル、1-(1-クロロエトキシ)インデン-2-イル、1-(1-ブロモエトキシ)インデン-2-イル、1-(2-フルオロエトキシ)インデン-2-イル、1-(2-ブロモエトキシ)インデン-2-イル、1-フルオロメトキシインデン-3-イル、1-クロロメトキシインデン-3-イル、1-ブロモメトキシインデン-3-イル、1-(1-フルオロエトキシ)インデン-3-イル、1-(1-ブロモエトキシ)インデン-3-イル、1-(2-フルオロエトキシ)インデン-3-イル、1-(2-クロロエトキシ)インデン-3-イル、1-(2-ブロモエトキシ)インデン-3-イル、1-フルオロメトキシインデン-4-イル、1-クロロメトキシインデン-4-イル、1-ブロモメトキシインデン-4-イル、1-(1-フルオロエトキシ)インデン-4-イル、1-(1-クロロエトキシ)インデン-4-イル、1-(1-ブロモエトキシ)インデン-4-イル、1-(2-フルオロエトキシ)インデン-4-イル、1-(2-クロロエトキシ)インデン-4-イル、1-(2-ブロモエトキシ)インデン-4-イル、1-フルオロメトキシインデン-5-イル、1-クロロメトキ

シインデン-5-イル、1-プロモメトキシインデン-5-イル、1-(1-フルオロエトキシ)インデン-5-イル、1-(1-クロロエトキシ)インデン-5-イル、1-(1-プロモエトキシ)インデン-5-イル、1-(2-フルオロエトキシ)インデン-5-イル、1-(2-クロロエトキシ)インデン-5-イル、1-(2-プロモエトキシ)インデン-5-イル、1-フルオロメトキシインデン-6-イル、1-クロロメトキシインデン-6-イル、1-プロモメトキシインデン-6-イル、1-(1-フルオロエトキシ)インデン-6-イル、1-(1-クロロエトキシ)インデン-6-イル、1-(1-プロモエトキシ)インデン-6-イル、1-(2-フルオロエトキシ)インデン-6-イル、1-(2-クロロエトキシ)インデン-6-イル、1-(2-プロモエトキシ)インデン-6-イル、1-フルオロメトキシインデン-7-イル、1-クロロメトキシインデン-7-イル、1-(1-フルオロエトキシ)インデン-7-イル、1-(1-クロロエトキシ)インデン-7-イル、1-(1-プロモエトキシ)インデン-7-イル、1-(2-フルオロエトキシ)インデン-7-イル、1-(2-クロロエトキシ)インデン-7-イル等が挙げられるが、これらに限定されない。

上記のヒドロキシ基で置換されたアリール基としては、例えば2-ヒドロキシフェニル、2-ヒドロキシナフタレン-1-イル、3-ヒドロキシフェニル、3-ヒドロキシナフタレン-1-イル、4-ヒドロキシフェニル、4-ヒドロキシナフタレン-1-イル、5-ヒドロキシナフタレン-1-イル、6-ヒドロキシナフタレン-1-イル、7-ヒドロキシナフタレン-1-イル、8-ヒドロキシナフタレン-1-イル、1-ヒドロキシインデン-1-イル、1-ヒドロキシインデン-2-イル、1-ヒドロキシインデン-3-イル、1-ヒドロキシインデン-4-イル、1-ヒドロキシインデン-5-イル、1-ヒドロキシインデン-6-イル、1-ヒドロキシインデン-7-イル、1,4-ジヒドロキシインデン-1-イル、1,5-ジヒドロキシインデン-2-イル、2,5-ジヒドロキシインデン-3-イル、1,3-ジヒドロキシインデン-4-イル、1,3-ジヒドロキシインデン-5-イル、2,4-ジヒドロキシインデン-6-イル、1,

4-ジヒドロキシインデン-7-イル等が挙げられる。

上記の「アシリル基」とは、後述する「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基としての「アシリル基」と同意義である。

上記のアシリル基で置換されたアリール基としては、例えば2-アセチルフェニル、2-アセチルナフタレン-1-イル、3-アセチルフェニル、3-アセチルナフタレン-1-イル、4-アセチルフェニル、4-アセチルナフタレン-1-イル、5-アセチルナフタレン-1-イル、6-アセチルナフタレン-1-イル、7-アセチルナフタレン-1-イル、8-アセチルナフタレン-1-イル、1-アセチルインデン-1-イル、1-アセチルインデン-2-イル、1-アセチルインデン-3-イル、1-アセチルインデン-4-イル、1-アセチルインデン-5-イル、1-アセチルインデン-6-イル、1-アセチルインデン-7-イル、1-アセチルインデン-2-イル、3-アセチルインデン-2-イル、4-アセチルインデン-2-イル、5-アセチルインデン-2-イル、6-アセチルインデン-2-イル、7-アセチルインデン-2-イル、1-アセチルインデン-3-イル、2-アセチルインデン-3-イル、4-アセチルインデン-3-イル、5-アセチルインデン-3-イル、6-アセチルインデン-3-イル、7-アセチルインデン-3-イル、1-アセチルインデン-4-イル、2-アセチルインデン-4-イル、3-アセチルインデン-4-イル、5-アセチルインデン-4-イル、6-アセチルインデン-4-イル、7-アセチルインデン-4-イル、等が挙げられるが、これらに限定されない。

上記のアミノ基で置換されたアリール基としては、例えば2-アミノフェニル、2-アミノナフタレン-1-イル、3-アミノフェニル、3-アミノナフタレン-1-イル、4-アミノフェニル、4-アミノナフタレン-1-イル、5-アミノナフタレン-1-イル、6-アミノナフタレン-1-イル、7-アミノナフタレン-1-イル、8-アミノナフタレン-1-イル等が挙げられる。

G<sup>1</sup>中のAは、好ましくは酸素原子である。

G<sup>1</sup>中のR<sup>1</sup>～R<sup>6</sup>で示される「ハロゲン原子」は、前記と同意義である。

G<sup>1</sup>中のR<sup>1</sup>～R<sup>6</sup>で示される「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の脂肪族炭化水素基とは、直鎖状または分枝状の脂肪族炭化水素基（アルキル基、ア

ルケニル基、アルキニル基等)を意味する。

上記の「脂肪族炭化水素基」のアルキル基の例としては、例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、ペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、tert-ペンチル、1-エチルプロピル、ヘキシル、イソヘキシル、ヘプチル、オクチル、デシル、テトラヒドロゲラニル、ドデシル、トリデシル、テトラデシル、ヘキサデシル、オクタデシル、ノナデシル、エイコサニル等の直鎖状または分枝状の炭素数1ないし20のアルキル基等が挙げられる。より好ましくは、炭素数1ないし10のアルキル基である。

上記の「脂肪族炭化水素基」のアルケニル基の例としては、例えばビニル、アリル、イソプロペニル、1-プロペニル、2-メチル-1-プロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、2-エチル-1-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、4-メチル-3-ペンテニル、1-ヘキセニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル、1-ヘプテニル、1-オクテニル、ゲラニル、1-デセニル、1-テトラデセニル、1-オクタデセニル、9-オクタデセニル、1-エイコセニル、3, 7, 11, 15-テトラメチル-1-ヘキサデセニル等の直鎖状または分枝状の炭素数2ないし20のアルケニル基等が挙げられる。より好ましくは、炭素数2ないし8のアルケニル基である。

上記の「脂肪族炭化水素基」のアルキニル基の例としては、例えばエチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、2-ペンテン-4-イニル等の炭素数2ないし20の二重結合を有していてもよいアルキニル基等が挙げられる。より好ましくは、炭素数2ないし8のアルキニル基である。

G<sup>1</sup>中のR<sup>1</sup>～R<sup>6</sup>で示される「(置換されていてもよい脂肪族炭化水素基)-O-」とは酸素原子に前記定義した脂肪族炭化水素基が結合している基を意味し、例えばアルキルオキシ基、アルケニルオキシ基、アルキニルオキシ基等を意味する。

「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基の好ましい具体例としては、例えばハロゲン原子、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオ

キシ、低級アルキルカルボニルオキシ、カルボキシリ基、置換または非置換のカルバモイル基、シアノ基、置換または非置換のアミノ基、アミジノ基、アジド基、ニトロ基、ニトロソ基、メルカプト基、低級アルキルチオ基、スルホ基、置換または非置換の飽和または不飽和の脂環式炭化水素基、置換または非置換の単環式または縮合多環式アリール基、置換または非置換の複素環基、アシリル基等が挙げられる。「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基の数は1個～5個、好ましくは1個～3個である。置換基の位置は特に限定されない。

「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基としての「ハロゲン」とは、前記と同意義である。

「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基としての「低級アルコキシ基」は、前記と同意義である。

「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基としての「低級アルケニルオキシ」としては、例えばビニルオキシ、アリルオキシ、1-プロペニルオキシ、2-メチル-1-プロペニルオキシ、1-ブテニルオキシ、2-ブテニルオキシ、3-ブテニルオキシ、2-エチル-1-ブテニルオキシ、3-メチル-2-ブテニルオキシ、1-ペンテニルオキシ、2-ペンテニルオキシ、3-ペンテニルオキシ、4-ペンテニルオキシ、4-メチル-3-ペンテニルオキシ等の炭素数2ないし7のアルケニルオキシが挙げられる。

「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基としての「低級アルキルカルボニルオキシ」としては、例えばメチルカルボニルオキシ、エチルカルボニルオキシ、プロピルカルボニルオキシ、イソプロピルカルボニルオキシ、ブチルカルボニルオキシ、イソブチルカルボニルオキシ、t-ブチルカルボニルオキシ、ペンチルカルボニルオキシ、イソペンチルカルボニルオキシ、ネオペンチルカルボニルオキシ、t-ペンチルカルボニルオキシ、ヘキシリカルボニルオキシ等の炭素数2ないし7のアルキルカルボニルオキシが挙げられる。

「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基としての「置換カルバモイル基」としては、例えばN-モノ低級アルキルカルバモイル基、N-, N-ジ低級アルキルカルバモイル基、N-ヒドロキシカルバモイル基、N-低級アルコキシカルバモイル基、N-ヒドロキシ-N-低級アルキルカルバモイル基、N-低

級アルコキシ-N-低級アルキルカルバモイル基、N-フェニルカルバモイル基、N-置換フェニルカルバモイル基等が挙げられる。

上記の「N-モノ低級アルキルカルバモイル基」としては、その低級アルキルは前記定義と同一であり、例えばN-メチルカルバモイル、N-エチルカルバモイル、N-プロピルカルバモイル、N-イソプロピルカルバモイル、N-ペンチルカルバモイル、N-イソペンチルカルバモイル、N-ネオペンチルカルバモイル、N-t-ペンチルカルバモイル、N-1-エチルプロピルカルバモイル、N-ヘキシリカルバモイル等が挙げられる。

上記の「N, N-ジ低級アルキルカルバモイル基」としては、その低級アルキルは前記定義と同一であり、例えばN, N-ジメチルカルバモイル、N-エチル-N-メチルカルバモイル、N, N-ジエチルカルバモイル、N-メチル-N-プロピルカルバモイル、N-ブチル-N-メチルカルバモイル、N-ブチル-N-エチルカルバモイル、N-ブチル-N-プロピルカルバモイル、N-ブチル-N-イソプロピルカルバモイル、N, N-ジブチルカルバモイル、N-エチル-N-プロピルカルバモイル、N, N-ジプロピルカルバモイル、N-イソプロピル-N-n-プロピルカルバモイル、N-イソプロピル-N-メチルカルバモイル等が挙げられる。

上記の「N-ヒドロキシ-N-低級アルキルカルバモイル基」としては、その低級アルキルは前記定義と同一であり、例えばN-ヒドロキシ-N-メチルカルバモイル、N-ヒドロキシ-N-エチルカルバモイル、N-ヒドロキシ-N-プロピルカルバモイル、N-ヒドロキシ-N-ブチルカルバモイル、N-ヒドロキシ-N-イソプロピルカルバモイル、N-ヒドロキシ-N-イソブチルカルバモイル、N-ヒドロキシ-N-t-ブチルカルバモイル、N-ヒドロキシ-N-ペンチルカルバモイル、N-ヒドロキシ-N-イソペンチルカルバモイル等の炭素数2ないし7のN-ヒドロキシ-N-低級アルキルカルバモイル基が挙げられる。

上記の「N-低級アルコキシ-N-低級アルキルカルバモイル基」としては、その低級アルキルは前記定義と同一であり、その全体の炭素数は3ないし13で

あるN-低級アルコキシ-N-低級アルキルカルバモイル基、例えばN-メトキシ-N-メチルカルバモイル、N-メトキシ-N-エチルカルバモイル、N-メトキシ-N-プロピルカルバモイル、N-メトキシ-N-ブチルカルバモイル、N-メトキシ-N-イソプロピルカルバモイル、N-メトキシ-N-イソブチルカルバモイル、N-メトキシ-N-sec-ブチルカルバモイル、N-メトキシ-N-t-ブチルカルバモイル、N-メトキシ-N-ペンチルカルバモイル、N-メトキシ-N-イソペンチルカルバモイル、N-メトキシ-N-ネオペンチルカルバモイル等が挙げられる。

上記の「N-置換フェニルカルバモイル基」の置換基としては、低級アルキル、低級アルコキシ、ヒドロキシ基等が挙げられ、それらの意味は前記定義と同様である。「N-置換フェニルカルバモイル基」の好ましい具体例としては、例えば(4-メチルフェニル)カルバモイル、(4-エチルフェニル)カルバモイル、(4-ヒドロキシフェニル)カルバモイル、(4-メトキシフェニル)カルバモイル、(2, 3-ジヒドロキシフェニル)カルバモイル、(2, 3-メトキシフェニル)カルバモイル、(2, 4-ジヒドロキシフェニル)カルバモイル、(2, 4-メトキシフェニル)カルバモイル、(2, 6-ジヒドロキシフェニル)カルバモイル、(2, 6-メトキシフェニル)カルバモイル、(2, 4, 6-トリヒドロキシフェニル)カルバモイル、(2, 4, 6-トリメトキシフェニル)カルバモイル、(2, 4-ジメトキシ-6-ヒドロキシフェニル)カルバモイル、(2, 6-ジメトキシ-4-ヒドロキシフェニル)カルバモイル、(4, 6-ジヒドロキシ-2-メトキシフェニル)カルバモイル、(2, 6-ジヒドロキシ-4-メトキシフェニル)カルバモイル、(2, 3, 4-トリメトキシフェニル)カルバモイル、(2, 3-ジメトキシ-4-ヒドロキシフェニル)カルバモイル、(2, 3-ジヒドロキシ-4-メトキシフェニル)カルバモイル、(3, 4-ジメトキシ-2-ヒドロキシフェニル)カルバモイル、(2, 4-ジヒドロキシ-3-メトキシフェニル)カルバモイル、(2, 4-ジメトキシ-6-メチルフェニル)カルバモイル、(2, 6-ジメトキシ-4-メチルフェニル)カルバモイル等が挙げられる。

$R^1 \sim R^6$ の定義中および「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基としての「置換アミノ基」としては、例えばモノ低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルキルカルボニルアミノ基等が挙げられる。

上記の「モノ低級アルキルアミノ基」としては、その低級アルキルは前記定義と同一であり、例えばメチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、ブチルアミノ、イソブチルアミノ、sec-ブチルアミノ、t-ブチルアミノ、ペンチルアミノ、イソペンチルアミノ、ヘキシルアミノ等の炭素数1ないし6のモノ低級アルキルアミノ基が挙げられる。

上記の「ジ低級アルキルアミノ基」としては、その低級アルキルは前記定義と同一であり、その全体の炭素数は2ないし20であるジ低級アルキルアミノ基、例えばジメチルアミノ、エチルメチルアミノ、ジエチルアミノ、メチルプロピルアミノ、エチルプロピルアミノ、イソプロピルメチルアミノ、イソプロピルエチルアミノ、ブチルメチルアミノ、ブチルエチルアミノ、イソブチルメチルアミノ、イソブチルエチルアミノ等が挙げられる。

上記の「低級アルキルカルボニルアミノ基」としては、その低級アルキルは前記定義と同一であり、例えばメチルカルボニルアミノ、エチルカルボニルアミノ、プロピルカルボニルアミノ、イソプロピルカルボニルアミノ、ブチルカルボニルアミノ、イソブチルカルボニルアミノ、sec-ブチルカルボニルアミノ、t-ブチルカルボニルアミノ、ペンチルカルボニルアミノ、イソペンチルカルボニルアミノ等の炭素数2ないし7のアルキルカルボニルアミノ基が挙げられる。

「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基としての「低級アルキルチオ基」としては、その低級アルキルは前記定義と同一であり、例えばメチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ、ブチルチオ、イソブチルチオ、ネオブチルチオ、t-ブチルチオ、ペンチルチオ、ヘキシルチオ等の炭素数1ないし6の低級アルキルチオ基が挙げられる。

「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基としての「置換または非置換の飽和または不飽和の脂環式炭化水素基」としては、例えばシクロアルキル基、シクロアルケニル基、シクロアルカジエニル基等が挙げられ、その意味するところは、前記A<sub>r1</sub>およびA<sub>r2</sub>で示される「置換されていてもよい環式基」

における相当する意味と同様である。

「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基としての「置換または非置換の単環式または縮合多環式アリール基」の意味するところは、前記A<sub>r</sub><sup>1</sup>およびA<sub>r</sub><sup>2</sup>で示される「置換されていてもよい環式基」における相当する意味と同様である。  
5

「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基としての「置換または非置換の複素環基」の複素環基の意味するところは、前記A<sub>r</sub><sup>1</sup>およびA<sub>r</sub><sup>2</sup>で示される「置換されていてもよい環式基」における相当する意味と同様である。

上記の「置換の飽和または不飽和の脂環式炭化水素基」、「置換の単環式または縮合多環式アリール基」、「置換の複素環基」の置換基の好ましい例としては、例えばハロゲン、ヒドロキシ基、低級アルキル基、置換基（ハロゲン、ヒドロキシ基、低級アルコキシまたは低級アルキルカルボニル基）で置換された低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、低級アルキルカルボニルオキシ基、カルボキシル基、低級アルキルカルボニル基、低級アルコキシカルボニル基、カルバモイル基、低級アルキルカルバモイル基、N-ジ低級アルキルカルバモイル基、N-ヒドロキシカルバモイル基、N-ヒドロキシ-N-低級アルキルカルバモイル基、N-フェニルカルバモイル基、N-置換フェニルカルバモイル基、シアノ基、アミノ基、モノ低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルキルカルボニルアミノ基、アミジノ基、アジド基、ニトロ基、ニトロソ基、メルカプト基、低級アルキルチオ基、スルホ基、飽和または不飽和の脂環式炭化水素基、単環式または縮合多環式アリール基、複素環基等が挙げられる。置換基があるとすれば、その数は1個～3個、好ましくは1個である。置換基の位置は特に限定されない。  
10  
15  
20

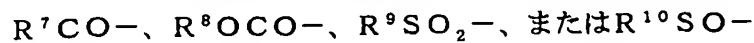
上記の「低級アルキルカルボニル基」の好ましい例としては、その低級アルキルは前記定義と同一であり、例えばアセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、バレリル、イソバレリル、ピバロイル、ヘキサノイル等の炭素数2ないし6のアルカノイル基が挙げられる。  
25

上記の「低級アルコキシカルボニル基」の好ましい例としては、その低級アルコキシは前記定義と同一であり、例えばメトキシカルボニル、エトキシカルボニ

ル、 $n$ -プロポキシカルボニル、 $n$ -ブトキシカルボニル等の炭素数2ないし7のアルコキシカルボニル基が挙げられる。

それ以外の置換基の意味するところは、「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基の用語として述べた通りである。

5  $R^1 \sim R^6$ の定義中および「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基としての「アシル基」とは、置換されていてもよいカルボン酸、置換されていてもよいオキシカルボン酸、置換されていてもよいスルホン酸、置換されていてもよいスルフィン酸等から由来するアシル基等が挙げられる。具体的には、式：



10 [式中、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^9$ および $R^{10}$ はそれぞれ置換されていてもよい炭化水素基または複素環基を示す]

で表わされる基等が挙げられる。

15 上記 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^9$ および $R^{10}$ で示される「置換されていてもよい炭化水素基または複素環基」における「炭化水素基」としては、例えば、非環式基としては直鎖状または分枝状の脂肪族炭化水素基（アルキル基、アルケニル基、アルキニル基等）等が挙げられ、環式基としては飽和または不飽和の脂環式炭化水素基（シクロアルキル基、シクロアルケニル基、シクロアルカジエニル基等）、単環式または縮合多環式アリール基等が挙げられる。これらの意味するところと置換基の具体例は、前述した通りである。

20  $G^1$ 中の $R^1 \sim R^6$ で示される「置換されていてもよいアミノ基」の置換基としては、例えばヒドロキシ基、低級アルキル基、置換基（ハロゲン、ヒドロキシ基、低級アルコキシまたは低級アルキルカルボニル基）で置換された低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、低級アルキルカルボニルオキシ基、カルボキシル基、低級アルキルカルボニル基、低級アルコキシカルボニル基、カルバモイル基、低級アルキルカルバモイル基、N-ジ低級アルキルカルバモイル基、N-ヒドロキシカルバモイル基、N-ヒドロキシ-N-低級アルキルカルバモイル基、N-フェニルカルバモイル基、N-置換フェニルカルバモイル基、飽和または不飽和の脂環式炭化水素基、単環式または縮合多環式アリール基、複素環基等が挙げられる。それぞれの置換基の意味するところ

は、前述した通りである。

G<sup>1</sup>中のR<sup>1</sup>～R<sup>6</sup>で示される「置換されていてもよいスルホ基」の置換基としては、例えばヒドロキシ基、低級アルキル基、置換基（ハロゲン、ヒドロキシ基、低級アルコキシまたは低級アルキルカルボニル基）で置換された低級アルキル基、  
5 低級アルケニル基、低級アルキニル基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、低級アルキルカルボニルオキシ基、カルボキシル基、低級アルキルカルボニル基、低級アルコキシカルボニル基、カルバモイル基、低級アルキルカルバモイル基、N-ジ低級アルキルカルバモイル基、N-ヒドロキシカルバモイル基、  
10 N-ヒドロキシ-N-低級アルキルカルバモイル基、N-フェニルカルバモイル基、N-置換フェニルカルバモイル基、シアノ基、アミノ基、モノ低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルキルカルボニルアミノ基、ニトロ基、飽和または不飽和の脂環式炭化水素基、単環式または縮合多環式アリール基、複素環基等が挙げられる。それぞれの置換基の意味するところは、前述した通りである。

15 G<sup>1</sup>中のR<sup>1</sup>～R<sup>6</sup>で示される「置換されていてもよいアリール基」のアリール基の意味するところは、前述した通りである。

G<sup>1</sup>中のR<sup>1</sup>～R<sup>6</sup>で示される「置換されていてもよいアリール基」の置換基としては、前記「置換の飽和または不飽和の脂環式炭化水素基」、「置換の単環式または縮合多環式アリール基」、「置換の複素環基」の置換基と同様なものが挙げられる。それぞれの置換基の意味するところは、前述した通りである。

20 G<sup>1</sup>中のR<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>またはR<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>が一緒になって形成される「置換されていてもよいメチレン基」の置換基としては、例えばハロゲン、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、低級アルキルカルボニルオキシ基、カルボキシル基、置換または非置換のカルバモイル基、シアノ基、置換または非置換のアミノ基、アミジノ基、アジド基、ニトロ基、ニトロソ基、メルカプト基、低級アルキルチオ基、スルホ基、アシル基等が挙げられる。それぞれの置換基の意味するところは、前述した通りである。

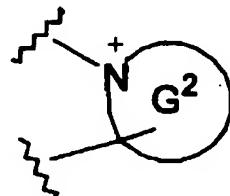
25 G<sup>1</sup>中のR<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>またはR<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>が一緒になって形成される「置換されていてもよいイミノ基」の置換基としては、例えばハロゲン、

ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、低級アルキルカルボニルオキシ基、カルボキシリ基、置換または非置換のカルバモイル基、メルカプト基、低級アルキルチオ基、スルホ基、アシル基等が挙げられる。それぞれの置換基の意味するところは、前述した通りである。

5 G<sup>1</sup>中のR<sup>1</sup>～R<sup>6</sup>は、好ましくはそれぞれ同一または異なって水素原子または低級アルキル基である。

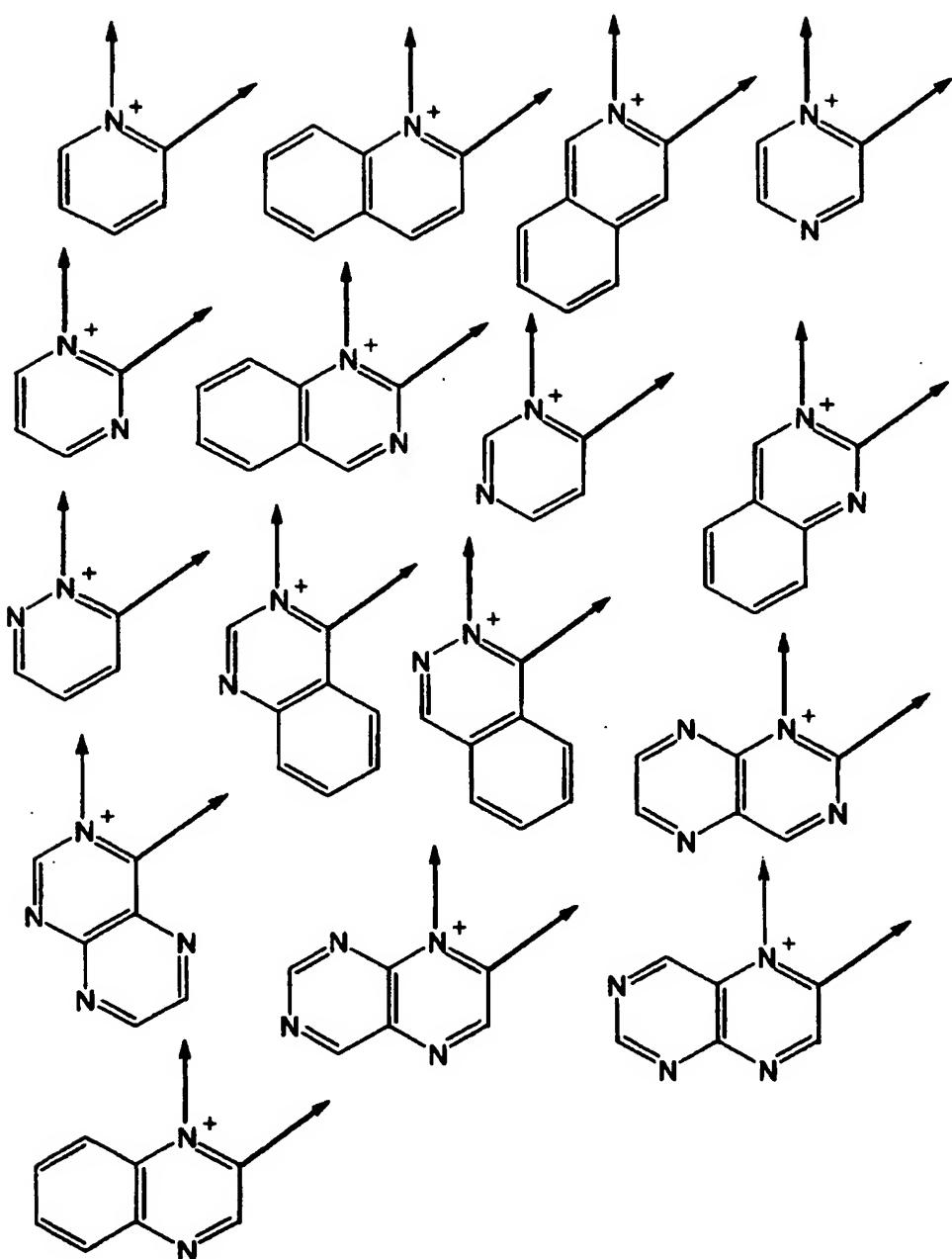
G<sup>1</sup>は好ましくは、-O-または-O-CR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>-である。

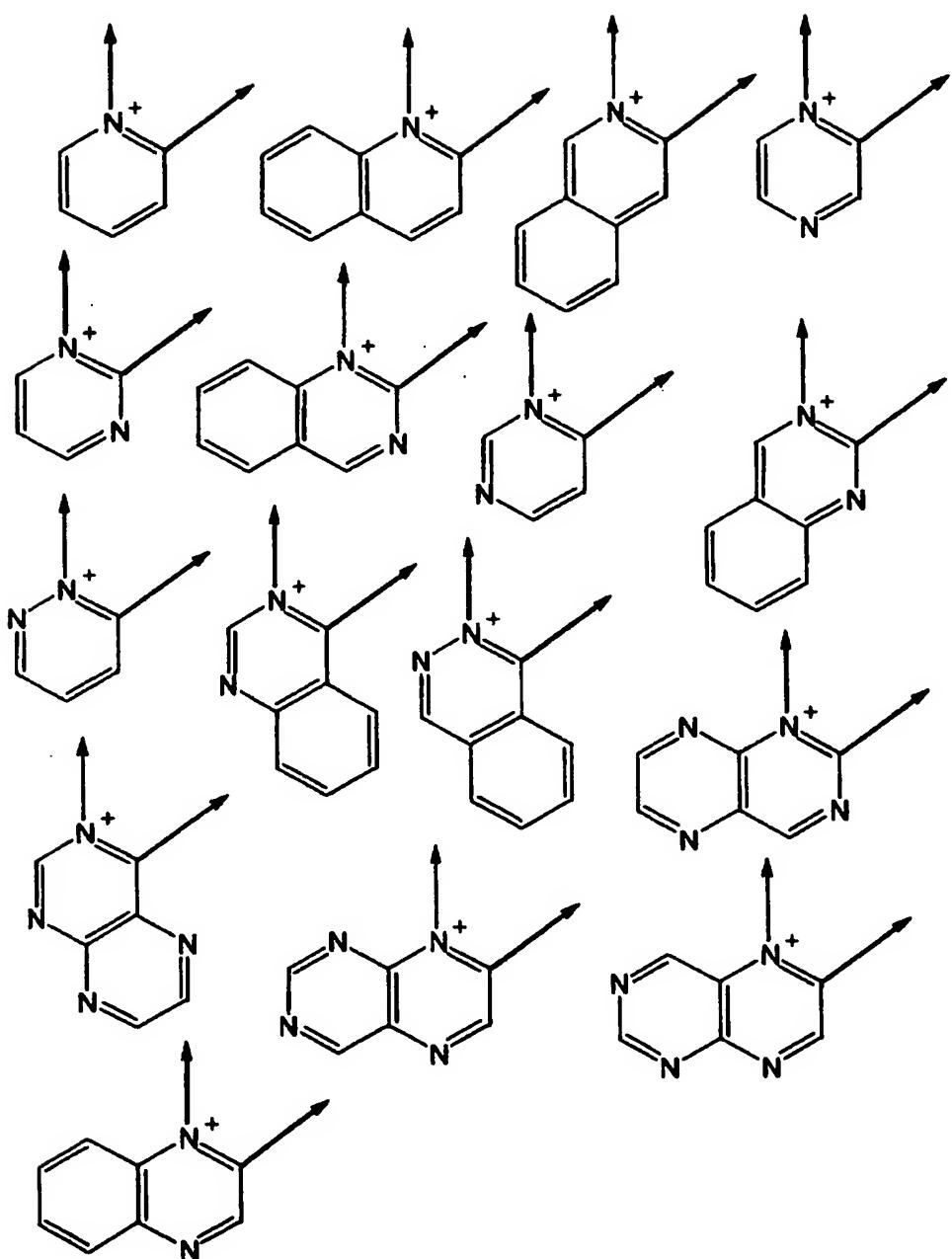
式：



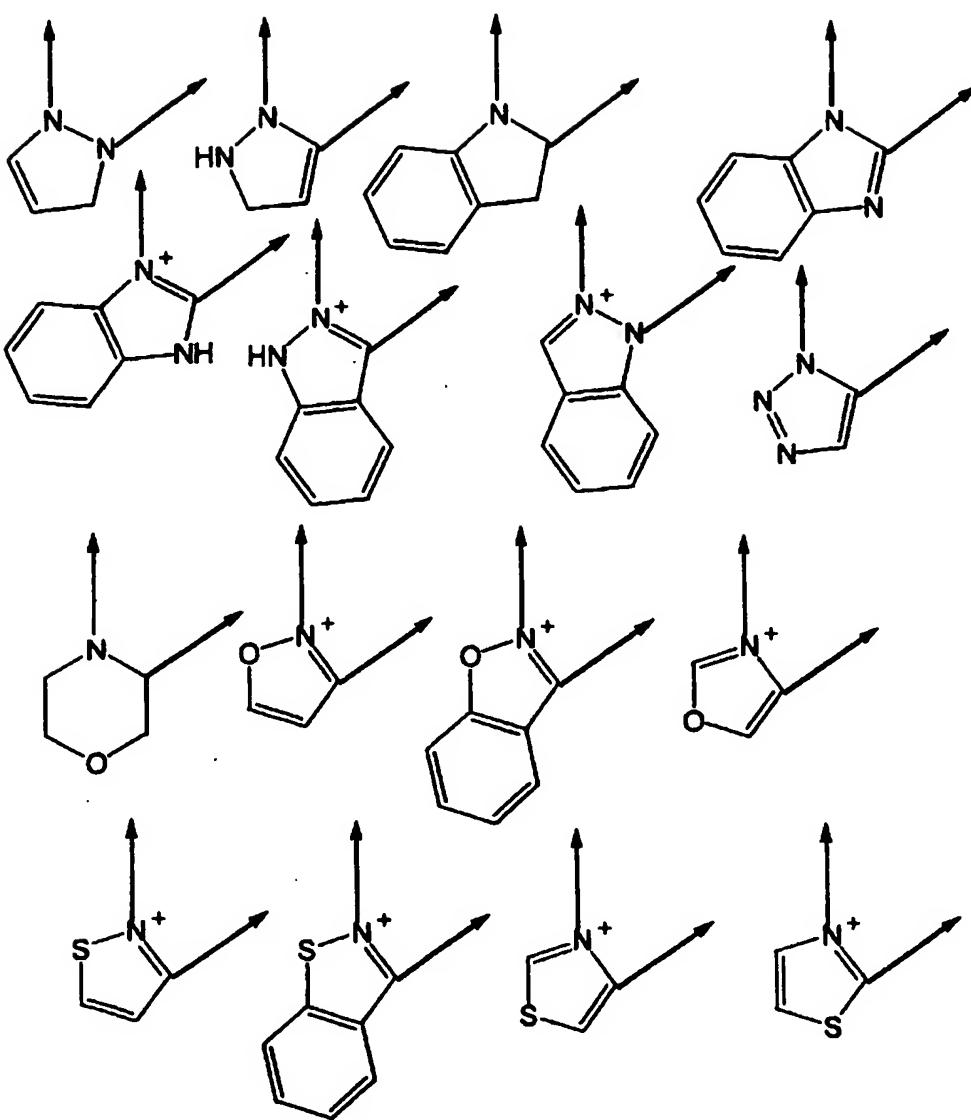
10 で示される、「置換されていてもよいアザ環式基（以下、該基を「G<sup>2</sup>」と便宜的に略す）」は単環または縮合環のいずれであってもよい。例えば、以下の環式基が挙げられる。なお、以下の式中、ホウ素と結合している環内窒素原子にプラスを付していないものであっても、その窒素原子は水素または置換されていてもよい脂肪族炭化水素基（好ましくは、低級アルキル基（例、メチル等））で置換されてプラスイオンを帶びているものとする。

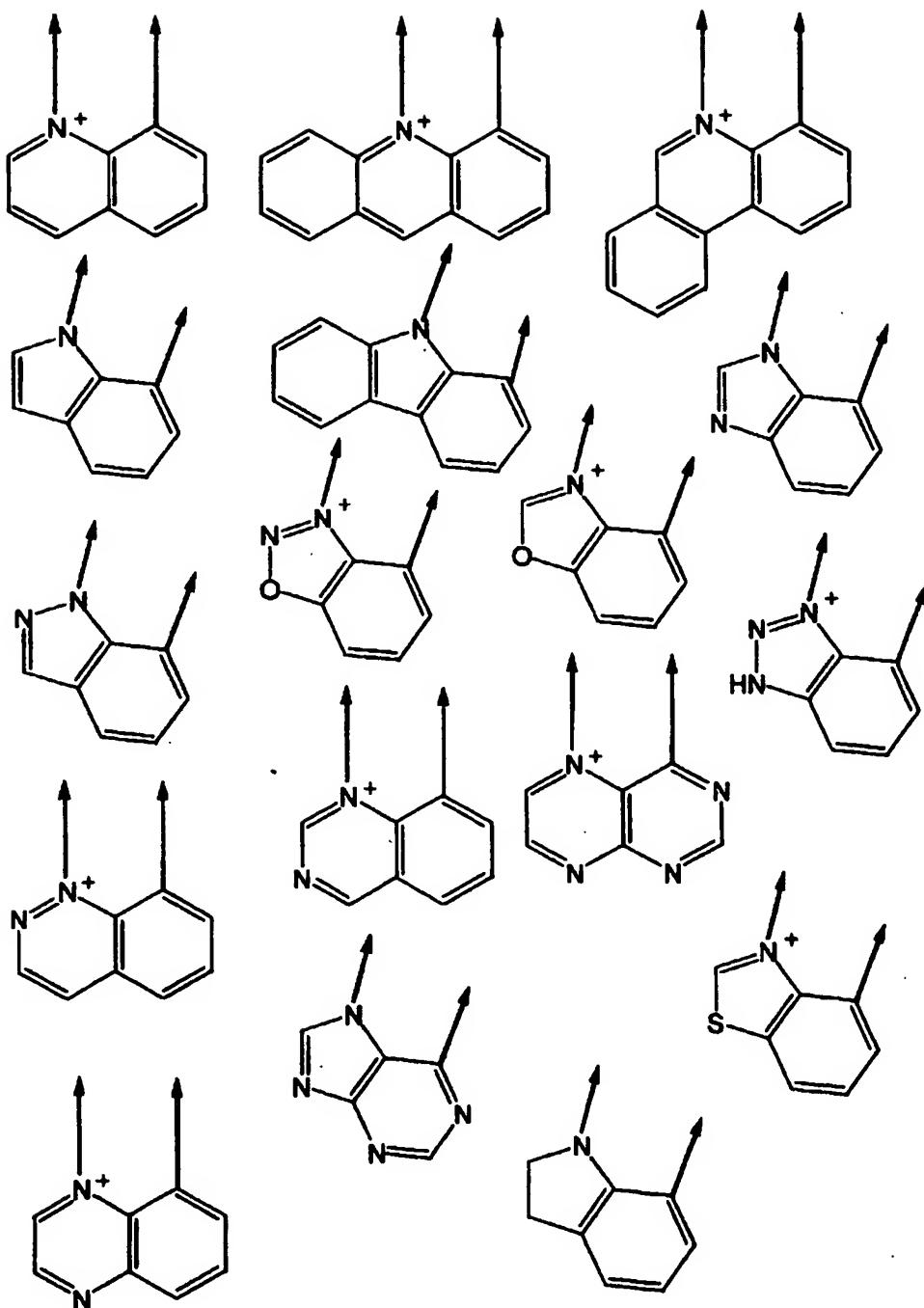
15



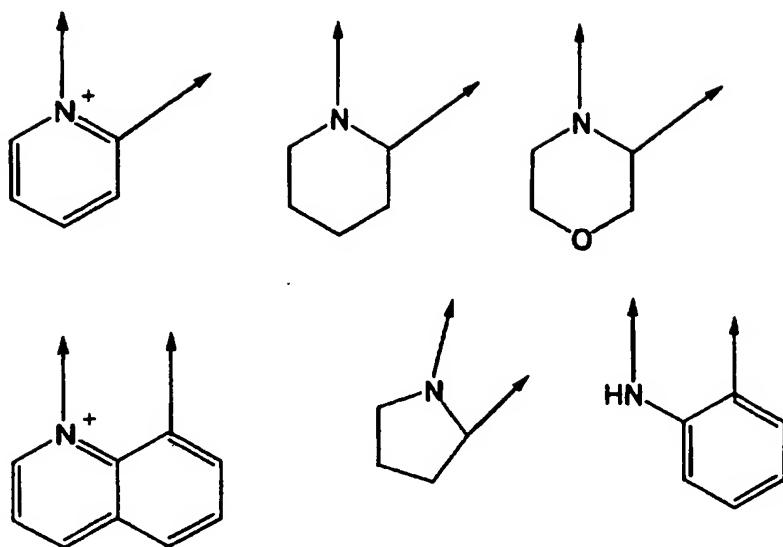


35





上記環式基のさらに好ましい例としては、以下の環式基が挙げられる。



一般式 (I) の定義中、「ただし、B<sup>-</sup>、G<sup>1</sup>およびG<sup>2</sup>から構成される環のうち最小環は5員環または6員環であるものとする」とは式 (I) 中、B<sup>-</sup>、鎖式基であるG<sup>1</sup>および基：G<sup>2</sup>中におけるホウ素と結合している窒素原子を含む環のうち最小の員数の環が5員または6員であることを意味している。

一般式 (I) 中、A<sub>r<sup>1</sup></sub>およびA<sub>r<sup>2</sup></sub>が同一であり、ともに置換されていてもよいアリール基である化合物もしくはその塩またはそれらの水和物を含有する動物（ヒトを除く）用医薬組成物が好ましく、より好ましくは一般式 (I) 中、A<sub>r<sup>1</sup></sub>およびA<sub>r<sup>2</sup></sub>がともに置換されていてもよいアリール基であり、G<sup>1</sup>が式：—O—、—O—CR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>—または—O—CR<sup>3</sup>R<sup>4</sup>—CR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>—で表される基（式中、R<sup>1</sup>～R<sup>6</sup>はそれぞれ同一または異なって水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよい低級アルケニル基、置換されていてもよい低級アルキルオキシ基、置換されていてもよい低級アルケニルオキシ基）である化合物もしくはその塩またはそれらの水和物を含有する動物（ヒトを除く）用医薬組成物である。

式 (II) 中、A<sub>r<sup>01</sup></sub>で示される置換されていてもよいアリール基は前記の定義と同義である。ただし、ここでは1位がナフタレン-1-イルで置換されているナフタレン-2-イルを除く。

A<sub>r<sup>02</sup></sub>で示される置換されていてもよい縮合アリール基（ただし、該縮合アリール基がナフタレン-2-イルである場合は、その1位がナフタレン-1-イ

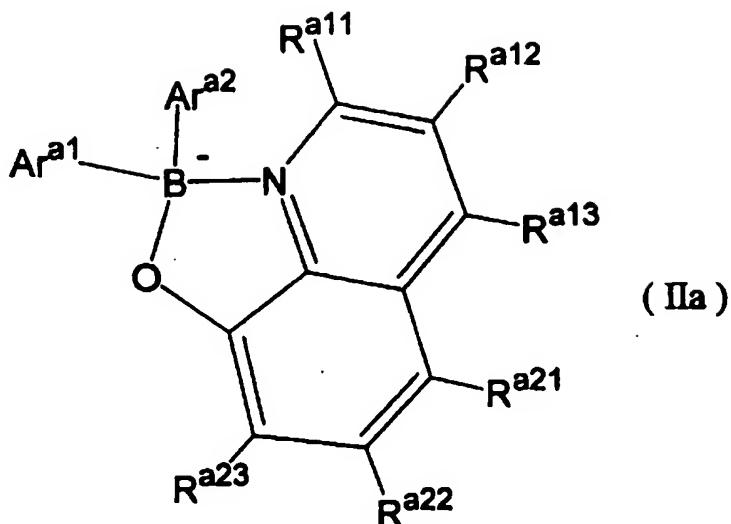
ルで置換されている場合を除く) としては、インデニル(1-インデニル、2-インデニル、3-インデニル、4-インデニル、5-インデニル、6-インデニル、7-インデニル)、ナフチル(1-ナフチル、2-ナフチル等)、アントリル、フェナントリル、アセナフチレンイル、フルオレニル(9-フルオレニル、1-フルオレニル等)等が挙げられる。

置換されていてもよい縮合アリール基の置換基の具体例としては、例えばハロゲン、ヒドロキシ基、低級アルキル、置換基(ハロゲン、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基または低級アルキルカルボニル基)で置換された低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、低級アルキルカルボニルオキシ基、カルボキシル基、低級アルキルカルボニル基、低級アルコキシカルボニル基、カルバモイル基、低級アルキルカルバモイル基、N-ジ低級アルキルカルバモイル基、N-ヒドロキシカルバモイル基、N-ヒドロキシ-N-低級アルキルカルバモイル基、N-フェニルカルバモイル基、N-置換フェニルカルバモイル基、シアノ基、アミノ基、モノ低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルキルカルボニルアミノ基、アミジノ基、アジド基、ニトロ基、ニトロソ基、メルカプト基、低級アルキルチオ基、スルホ基、飽和または不飽和の脂環式炭化水素基、単環式または縮合多環式アリール基、複素環基等が挙げられる。置換基があるとすれば、その数は1個~3個、好ましくは1個である。置換基の位置は特に限定されない。

上記のうち、より好ましい置換基としては、ハロゲン原子、メチル、トリハロメチル、ヒドロキシ基、メトキシ、アミノ基またはスルホ基である。さらに好ましくは、フッ素、塩素、臭素、メチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、ヒドロキシ基、メトキシまたはスルホ基である。

R<sup>•1</sup>およびR<sup>•2</sup>中の各定義は前記の定義に従う。

式(I I)で示される化合物中、好ましくは、一般式(I I a) :



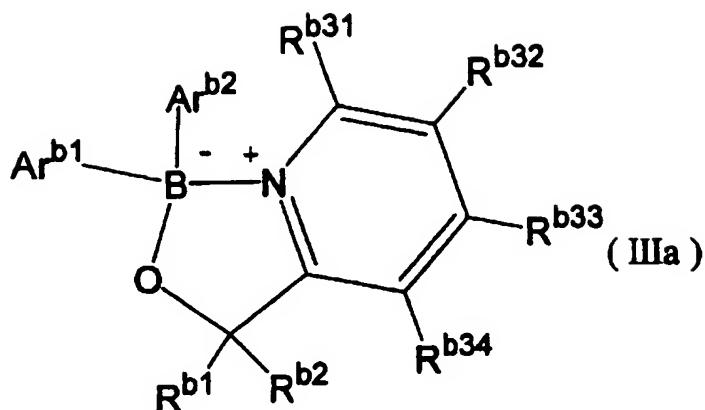
[式中、 $\text{Ar}^{\alpha 1}$ および $\text{Ar}^{\alpha 2}$ はともに置換されていてもよいアリールであり、 $\text{R}^{\alpha 11} \sim \text{R}^{\alpha 13}$ および $\text{R}^{\alpha 21} \sim \text{R}^{\alpha 23}$ はそれぞれ独立して同一または異なって水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、低級ハロアルキル基、ヒドロキシ基、置換されていてもよいアミノ基または置換されていてもよいスルホ基を示す]

5 で示される化合物である。より好ましくは、 $\text{R}^{\alpha 11} \sim \text{R}^{\alpha 13}$ および $\text{R}^{\alpha 21} \sim \text{R}^{\alpha 23}$ がそれぞれ独立して同一または異なって水素原子、ハロゲン原子、メチル、トリハロメチル、ヒドロキシ基、メトキシ、アミノ基またはスルホ基である化合物である。さらに好ましくは、 $\text{R}^{\alpha 11}$ 、 $\text{R}^{\alpha 21}$ 、 $\text{R}^{\alpha 23}$ がそれぞれ独立して同一または異なるフッ素、塩素、臭素、メチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、ヒドロキシ基、メトキシまたはスルホ基である化合物である。

10 式 (III) 中、 $\text{Ar}^{\beta 1}$ 、 $\text{Ar}^{\beta 2}$ 、 $\text{R}^{\beta 1}$ 、 $\text{R}^{\beta 2}$ 、 $\text{R}^{\beta 3}$ における各定義は前記の定義に従う。

15 式 (III) で示される化合物中、好ましくは、一般式 (IIIa) :

40



[式中、 $Ar^{b1}$ および $Ar^{b2}$ はともに置換されていてもよいアリールであり、 $R^{b1}$ および $R^{b2}$ はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシリルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または

5 $R^{b1}$ と $R^{b2}$ が一緒になってオキソ、置換されていてもよいメチレンもしくは置換されていてもよいイミノを形成する；  
10 $R^{b31}$ ～ $R^{b34}$ はそれぞれ独立して同一または異なって水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、低級ハロアルキル基、ヒドロキシ基、置換されていてもよいアミノ基または置換されていてもよいスルホ基を示す]

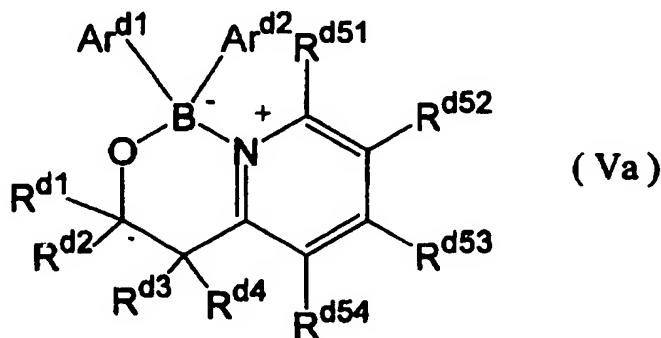
15で示される化合物である。より好ましくは、 $R^{b31}$ ～ $R^{b34}$ がそれぞれ独立して同一または異なって水素原子、ハロゲン原子、メチル、トリハロメチル、ヒドロキシ基、メトキシ、アミノ基またはスルホ基である化合物である。さらに好ましくは、 $R^{b32}$ 、 $R^{b33}$ 、 $R^{b34}$ がそれぞれ独立して同一または異なってフッ素、塩素、臭素、メチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、ヒドロキシ基、メトキシまたはスルホ基である化合物である。

20式 (IV) 中、 $Ar^{c1}$ 、 $Ar^{c2}$ 、 $R^{c1}$ 、 $R^{c2}$ 、 $R^{c3}$ における各定義は前記の定義に従う。

式 (IV) で示される化合物中、好ましくは  $Ar^{d1}$  および  $Ar^{d2}$  が置換されていてもよいアリールであり、 $R^{d3}$  がそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、低級ハロアルキル基、ヒドロキシ基、置換されていてもよいアミノ基または置換されていてもよいスルホ基を示す化合物である。さらに好ましくは、 $R^{d3}$  がそれぞれ独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、ヒドロキシ基、メトキシまたはスルホ基である化合物である。

式 (V) 中、 $Ar^{d1}$ 、 $Ar^{d2}$ 、 $R^{d1}$ 、 $R^{d2}$ 、 $R^{d3}$ 、 $R^{d4}$ 、 $R^{d5}$ における各定義は前記の定義に従う。

式 (V) で示される化合物中、好ましくは一般式 (Va) :



[式中、 $Ar^{d1}$  および  $Ar^{d2}$  は置換されていてもよいアリールであり、 $R^{d1}$ 、 $R^{d2}$ 、 $R^{d3}$  および  $R^{d4}$  はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシリルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または  $R^{d1}$  と  $R^{d2}$  および/または  $R^{d3}$  と  $R^{d4}$  が一緒になってオキソ、置換されていてもよいメチレンもしくは置換されていてもよいイミノを形成する；  
 $R^{d51}$ ～ $R^{d54}$  はそれぞれ独立して同一または異なって水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、低級ハロアルキル基、ヒドロキシ基、

置換されていてもよいアミノ基または置換されていてもよいスルホ基を示す]で示される化合物である。より好ましくは、 $R^{d51}$ ～ $R^{d54}$ がそれぞれ独立して同一または異なって水素原子、ハロゲン原子、メチル、トリハロメチル、ヒドロキシ基、メトキシ、アミノ基またはスルホ基である化合物である。さらに好ましくは、 $R^{d52}$ 、 $R^{d53}$ 、 $R^{d54}$ がそれぞれ独立して同一または異なってフッ素、塩素、臭素、メチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、ヒドロキシ基、メトキシまたはスルホ基である化合物である。

本発明は上記化合物の製薬的に許容される塩およびその水和物も包含する。

本発明の目的化合物の「塩」としては、製薬的に許容される塩が好ましく、例えば無機塩基との塩、有機塩基との塩、無機酸との塩、有機酸との塩、塩基性または酸性アミノ酸塩などが挙げられる。無機塩基との塩としては、ナトリウム塩、カリウム塩などのアルカリ金属塩、カルシウム塩、マグネシウム塩、バリウム塩などのアルカリ土類金属塩、ならびにアルミニウム塩、アンモニウム塩などが挙げられる。有機塩基との塩としては、トリメチルアミン、トリエチルアミン、ピリジン、ピコリン、エタノールアミン、ジエタノールアミン、トリエタノールアミン、ジシクロヘキシルアミン、N,N'-ジベンジルエチレンジアミンなどとの塩が挙げられる。無機酸との塩としては、塩酸、フッ化水素酸、臭化水素酸、硝酸、硫酸、リン酸、過塩素酸、ヨウ化水素酸などとの塩が挙げられる。有機酸との塩としては、ギ酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、フマル酸、シュウ酸、酒石酸、マレイン酸、クエン酸、コハク酸、リンゴ酸、マンデル酸、アスコルビン酸、乳酸、グルコン酸、メタンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸などとの塩が挙げられる。塩基性アミノ酸との塩としては、アルギニン、リジン、オルニチンなどとの塩が挙げられ、酸性アミノ酸との塩としては、アスパラギン酸、グルタミン酸などとの塩が挙げられる。

本発明の目的化合物およびその塩の「水和物」は製薬的に許容される水和物が好ましく、具体的には、一水和物、二水和物、六水和物等が挙げられる。

本発明は別の態様として、上記式(I)、(II)、(III)、(IV)または(V)で示される化合物もしくはその塩またはそれらの水和物を含有する動物(ヒトを除く)用医薬組成物、抗原虫剤、抗コクシジウム剤に関する。

本明細書中、「動物（ヒトを除く）用医薬組成物」とはヒト以外の動物における疾病的診断、治療または予防に使用される薬剤を意味し、本発明の動物用医薬組成物としての用途は抗コクシジウム剤、成長促進剤等、すべての動物用医薬としての用途が含まれる。本発明動物用医薬組成物の対象となる動物としては、  
5 ニワトリ、ガチョウ、キジ、七面鳥、アヒル等の家禽類、ウシ、ウサギ、ヒツジ、ヤギ、ブタ等の家畜類が挙げられる。

抗原虫剤は、トキソプラズマ、マラリアおよび下記コクシジア等を包含する原虫類の感染を予防または治療するための薬剤を意味する。

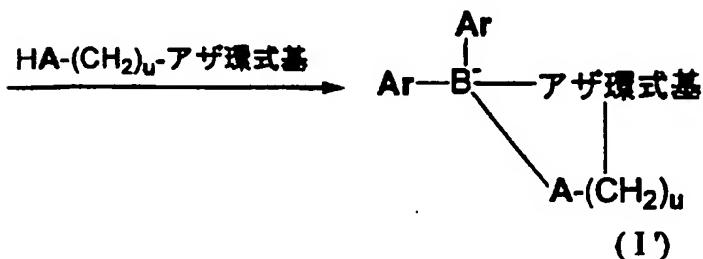
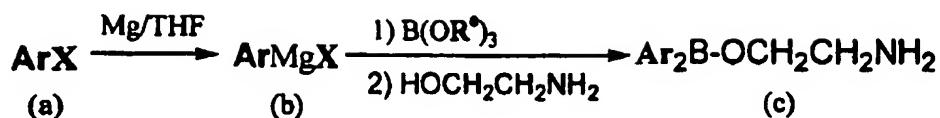
10 抗コクシジウム剤は、主なものとしてアイメリア・テネラ (*Eimeria tenella*)、アイメリア・アセルブリーナ (*Eimeria acervulina*) およびアイメリア・ネカトリックス (*Eimeria necatrix*) 等による感染の予防および治療のための薬剤を意味する。

#### 発明の実施の形態

本発明の化合物 (I) [すなわち、一般式 (I) で表される化合物。以下、他の式で表される化合物についても同様に略記することがある。]は、公知の文献  
15 (例、Youji Huaxue (1989), 9(3), 226-9、Pharmazie (1985), 40(11), 767-71、Pharmazie (1985), 40(6), 387-93、Pharmazie (1985), 40(5), 307-11、J. Chem. Soc. Perkin Trans. 2 (1992) 527-532、Journal of Organometallic Chemistry, 297(1985) 13-19) を参考にして、例えば以下に示す合成ルートによ  
20 つて製造することができる。

なお、これらのルートにおいて置換基の種類 ( $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$  および  $R^4$ ) によっては以下の反応において反応性を有することがある (例、ヒドロキシ基、カルボニル基およびアミノ基等) が、その場合は適宜置換基に保護基を導入し反応後除去することにより製造を行えばよい。

25 (反応式)



[式中、 $u$ は0、1または2の整数、 $R^{\circ}$ は炭素数1～8のアルキル基を示し、他の記号は前記と同意義である]

5 工程 1

まず、化合物(a)とマグネシウムをテトラヒドロフラン(THF)などのエーテル溶媒中で反応させることにより、式:  $A_rMgX$  (b) で示される化合物を製造する。本反応において、化合物(a)は、マグネシウムに対して1当量またはそれ以上、好ましくは1.1～1.3当量使用することができる。使用できるエーテル系溶媒としてはテトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジオキサンなどが挙げられる。さらに必要なら芳香族炭化水素類(例、トルエン、ベンゼン、キシレンなど)、または飽和炭化水素類(例、シクロヘキサン、ヘキサンなど)をエーテル系溶媒との混合溶媒として使用することができる。反応温度は-20～150℃、好ましくは0～50℃である。反応時間は化合物により異なるが0.5～10時間反応させればよい。反応生成物は通常透明溶液またはスラリーとして得られる。

工程 2

上記得られた化合物 (b) を含む溶液またはスラリーにホウ酸化合物 (B(OH)<sub>3</sub>)<sub>n</sub>) を反応させた後、さらにエタノールアミン ( $\text{HOCH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$ ) を適当な溶媒中で反応させることにより式 (c) で示される化合物を製造する。

本反応において、上記工程 1 で得られた化合物 (b) に対してホウ酸エチル

は0.5当量またはそれ以下、好ましくは0.5～0.4当量使用することができる。逐次反応のエタノールアミンは化合物（b）に対して0.5当量またはそれ以上、好ましくは0.5～0.7当量使用することができる。本反応においては必要なら工程1に記載したエーテル類、芳香族炭化水素類、飽和炭化水素類の溶媒を使用することができる。化合物（b）とホウ酸エステルとの反応温度は-90～100℃、好ましくは-30～40℃、反応時間は化合物により異なるが0.5～10時間反応させればよい。また、逐次反応のエタノールアミンとの反応温度は0～100℃、好ましくは30～80℃、反応時間は通常0.5～5時間反応させればよい。化合物（c）は粗製物として、あるいは常法（例、カラムクロマトグラフィー、再結晶など）により精製して次工程に使用することができる。

### 工程3

化合物（c）に式： $\text{HA}-(\text{CH}_2)_n-\text{アザ環式基}$

で表される化合物を適当な溶媒中で反応させることにより、式（I'）で示される本発明化合物を製造することができる。 $\text{HA}-(\text{CH}_2)_n-\text{アザ環式基}$ で表される化合物は化合物（c）に対して1～2当量、好ましくは1～1.5当量使用することができる。使用できる溶媒としては、エーテル類（例、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンなど）、炭化水素類（例、ベンゼン、トルエン、キシレンなど）、アルコール類（例、メタノール、エタノール、n-ブロパノールなど）、水およびそれらの混合溶媒などが挙げられる。反応温度は0～150℃、好ましくは20～120℃であり、反応時間は通常、0.5～10時間である。得られた所望の化合物（I'）は要すれば、例えばカラムクロマトグラフィー、再結晶などにより精製することができる。

25

### 実施例

以下に参考例および実施例を挙げて本発明をさらに詳細に説明するが、これらは本発明の範囲の限定を意図するものでない。

参考例および実施例中、Phはフェニル基、Naphはナフチル基、Me<sub>3</sub>S

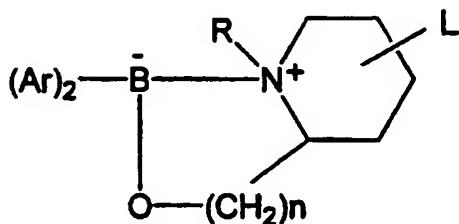
i-P hはトリメチルシリルフェニル基、t-B uはt-ブチル基、をそれぞれ意味する。

### 参考例 1

5 ジフェニルボロン酸エタノールアミンエステル( $\text{Ph}_2\text{B}-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$ )の合成

プロモベンゼン83.2 g(0.53mol)、マグネシウム12.9 g (0.53mol) およびテトラヒドロフラン250mlを用いて常法にてフェニルマグネシウムプロマイドのテトラヒドロフラン溶液を調製した。次いで、フラスコにホウ酸トリプチルエステル10 58.5 g (0.26mol)、エチルエーテル200 mlを仕込み、-60 °Cに冷却維持しフェニルマグネシウムプロマイドのテトラヒドロフラン溶液(グリニヤール試薬)を滴下した。滴下終了後、室温下で10時間攪拌した後、10%塩酸水溶液150 mlを加えて加水分解し有機層を分液した。得られた有機層にエタノールアミン31.1 g(0.51mol)、エタノール50 mlを加えて2時間室温下で攪拌した。生成した沈殿を濾集し、含水アルコールで再結晶し乾燥して白色結晶のジフェニルボロン酸エタノールアミンエステル31.9 g(収率55%)を得た。

以下の実施例1～4は下記式で示される化合物に関する：



20 実施例 1

化合物1(式中、nが1、Arがフェニル、RおよびLが水素)の合成

ジフェニルボロン酸エタノールアミンエステル2.6 g(0.012mol)、エチルエーテル30 mlおよび10%塩酸水溶液30mlをロートに仕込み、約15分間振り混ぜた後分液し、有機層を1回水洗しナスフラスコに移し替えた。その後、2-ヒドロキシメチルピペリジン2.1 g (0.018mol)とエタノール7mlを加えて室温下で2時

間攪拌した。生成した沈殿を濾集し、含水アルコールで再結晶し乾燥して白色結晶の化合物 1 を 2.8g (収率83%) 得た。

融点 : 169~171°C

### 5 実施例 2

化合物 2 (式中、n が 1、Ar が 2-メチルフェニル、R および L が水素) の合成

ジ (2-メチル) -フェニルボロン酸エタノールアミンエステル 3.04 g  
(0.012mol) と 2-ヒドロキシメチルピペリジン 2.10g (0.018mol) を化合物 1 の合成法と同様に反応、処理し白色結晶の化合物 2 を 2.18g (収率78%) 得た。

融点 : 126~128°C

### 実施例 3

#### 化合物 9 の合成

ジー (3-クロロ) -フェニルボロン酸エタノールアミンエステル 3.54g  
(0.012mol) と 2-ヒドロキシメチルピペリジン 2.10g (0.018mol) を化合物 1 の合成法と同様に反応、処理し白色結晶の化合物 9 を 3.28g (収率78%) 得た。

融点 : 155~159°C

### 20 実施例 4

#### 化合物 3 1 (表中、n が 1、Ar が α-ナフチル、R および L が水素) の合成

ジー α-ナフチルボロン酸エタノールアミンエステル 3.90 g (0.012mol) と 2-ヒドロキシメチルピペリジン 2.10g (0.018mol) を化合物 1 の合成法と同様に反応、処理し白色結晶の化合物 3 1 を 3.01g (収率79%) 得た。

融点 : 176~178°C

上記実施例 1 ~ 4 を参考にすれば、以下の表 1 ~ 6 中に示される化合物を製造することができる。

表 1

化合物 No.	n	Ar	R	L	融点 (°C)
1	1	Ph	H	H	169-171
2	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	H	H	126-128
3	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	H	H	203-205
4	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	H	H	134-136
5	1	2-F-Ph	H	H	
6	1	3-F-Ph	H	H	
7	1	4-F-Ph	H	H	134-136
8	1	2-Cl-Ph	H	H	
9	1	3-Cl-Ph	H	H	155-159
10	1	4-Cl-Ph	H	H	
11	1	2-Br-Ph	H	H	
12	1	3-Br-Ph	H	H	
13	1	4-Br-Ph	H	H	
14	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	H	H	
15	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	H	H	95-97
16	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	H	
17	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	H	
18	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	H	148-151
19	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	H	
20	1	4-tBu-Ph	H	H	
21	1	2-OPh-Ph	H	H	
22	1	3-OPh-Ph	H	H	
23	1	4-OPh-Ph	H	H	
24	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	H	
25	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	H	
26	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	H	
27	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	H	H	
28	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	H	H	
29	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	H	
30	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	H	
31	1	α-Naph	H	H	176-178
32	1	β-Naph	H	H	
33	1	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	H	H	

表 2

化合物 No.	n	Ar	R	L	融点 (°C)
34	2	Ph	H	H	
35	2	2-CH <sub>3</sub> -Ph	H	H	
36	2	3-CH <sub>3</sub> -Ph	H	H	
37	2	4-CH <sub>3</sub> -Ph	H	H	
38	2	2-F-Ph	H	H	
39	2	3-F-Ph	H	H	
40	2	4-F-Ph	H	H	
41	2	2-Cl-Ph	H	H	
42	2	3-Cl-Ph	H	H	
43	2	4-Cl-Ph	H	H	
44	2	2-Br-Ph	H	H	
45	2	3-Br-Ph	H	H	
46	2	4-Br-Ph	H	H	
47	2	2-CF <sub>3</sub> -Ph	H	H	
48	2	3-CF <sub>3</sub> -Ph	H	H	
49	2	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	H	
50	2	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	H	
51	2	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	H	
52	2	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	H	
53	2	4-tBu-Ph	H	H	
54	2	2-OPh-Ph	H	H	
55	2	3-OPh-Ph	H	H	
56	2	4-OPh-Ph	H	H	
57	2	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	H	
58	2	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	H	
59	2	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	H	
60	2	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	H	H	
61	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	H	H	
62	2	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	H	
63	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	H	
64	2	$\alpha$ -Naph	H	H	
65	2	$\beta$ -Naph	H	H	
66	2	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	H	H	

表 3

化合物 No.	n	Ar	R	L	融点 (°C)
67	1	Ph	CH <sub>3</sub>	H	
68	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
69	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
70	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
71	1	2-F-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
72	1	3-F-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
73	1	4-F-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
74	1	2-Cl-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
75	1	3-Cl-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
76	1	4-Cl-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
77	1	2-Br-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
78	1	3-Br-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
79	1	4-Br-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
80	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
81	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
82	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
83	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
84	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
85	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
86	1	4-tBu-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
87	1	2-OPh-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
88	1	3-OPh-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
89	1	4-OPh-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
90	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
91	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
92	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
93	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
94	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
95	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
96	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
97	1	α-Naph	CH <sub>3</sub>	H	
98	1	β-Naph	CH <sub>3</sub>	H	
99	1	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	CH <sub>3</sub>	H	

表 4

化合物 No.	n	Ar	R	L	融点 (°C)
100	2	Ph	CH <sub>3</sub>	H	
101	2	2-CH <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
102	2	3-CH <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
103	2	4-CH <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
104	2	2-F-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
105	2	3-F-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
106	2	4-F-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
107	2	2-Cl-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
108	2	3-Cl-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
109	2	4-Cl-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
110	2	2-Br-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
111	2	3-Br-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
112	2	4-Br-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
113	2	2-CF <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
114	2	3-CF <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
115	2	4-CF <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
116	2	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
117	2	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
118	2	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
119	2	4-tBu-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
120	2	2-OPh-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
121	2	3-OPh-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
122	2	4-OPh-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
123	2	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
124	2	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
125	2	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
126	2	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
127	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	CH <sub>3</sub>	H	
128	2	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
129	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H	
130	2	α-Naph	CH <sub>3</sub>	H	
131	2	β-Naph	CH <sub>3</sub>	H	
132	2	4-Me <sub>2</sub> Si-Ph	CH <sub>3</sub>	H	

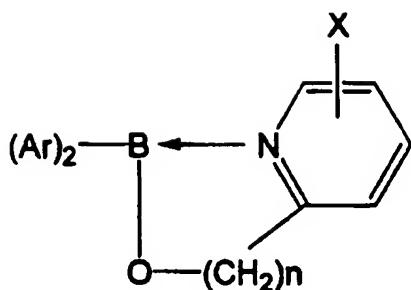
表 5

化合物 No.	n	Ar	R	L	融点 (°C)
133	1	Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
134	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
135	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
136	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
137	1	2-F-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
138	1	3-F-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
139	1	4-F-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
140	1	2-Cl-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
141	1	3-Cl-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
142	1	4-Cl-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
143	1	2-Br-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
144	1	3-Br-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
145	1	4-Br-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
146	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
147	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
148	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
149	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
150	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
151	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
152	1	4-tBu-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
153	1	2-OPh-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
154	1	3-OPh-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
155	1	4-OPh-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
156	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
157	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
158	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
159	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
160	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
161	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
162	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	
163	1	α-Naph	H	6-CH <sub>3</sub>	
164	1	β-Naph	H	6-CH <sub>3</sub>	
165	1	4-Me <sub>2</sub> Si-Ph	H	6-CH <sub>3</sub>	

表 6

化合物 No.	n	Ar	R	L	融点 (°C)
166	1	Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
167	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
168	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
169	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
170	1	2-F-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
171	1	3-F-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
172	1	4-F-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
173	1	2-Cl-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
174	1	3-Cl-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
175	1	4-Cl-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
176	1	2-Br-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
177	1	3-Br-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
178	1	4-Br-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
179	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
180	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
181	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
182	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
183	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
184	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
185	1	4-tBu-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
186	1	2-OPh-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
187	1	3-OPh-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
188	1	4-OPh-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
189	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
190	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
191	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
192	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
193	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
194	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
195	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
196	1	α-Naph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
197	1	β-Naph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	
198	1	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	H	3,5-Me <sub>2</sub>	

以下の実施例 5 および 6 は下記式で示される化合物に関する：

**実施例 5**

**化合物 199** (式中、 $n$ は1、 $Ar$ はフェニル、 $X$ は水素) の合成

ジフェニルボロン酸エタノールアミンエステル2.6 g (0.012mol) とエチルエーテル30 mlおよび10%塩酸水溶液30mlをロートに仕込み、約15分間振り混ぜた後分液し、有機層を1回水洗し有機層をナスフラスコに移し替えた。

2-ヒドロキメチルピリジン1.94g (0.018mol) およびエタノール7mlを加えて室温下で2時間攪拌した。生成した沈殿を濾集し含水アルコールで再結晶し、乾燥して白色結晶の化合物199を2.5g (収率76%) 得た。

10 融点：150～151°C

**実施例 6**

**化合物 246** ( $n$ は2、 $Ar$ は3-トリフルオロメチル、 $X$ は水素) の合成

ジ(3-トリフロロメチル)-フェニルボロン酸エタノールアミンエステル2.77 g (0.012mol) と2-ヒドロキシエチルピリジン2.21g (0.018mol) を化合物1の合成法と同様に反応、処理し白色結晶の化合物246を3.96g (収率78%) 得た。

融点：140～142°C

上記実施例5および6を参考にすれば、以下の表7～20中に示される化合物20を製造することができる。

表 7

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
199	1	Ph	H	150-151
200	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	H	188-192
201	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	H	117-119
202	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	H	147-149
203	1	2-F-Ph	H	
204	1	3-F-Ph	H	
205	1	4-F-Ph	H	137-139
206	1	2-Cl-Ph	H	
207	1	3-Cl-Ph	H	
208	1	4-Cl-Ph	H	133-134
209	1	2-Br-Ph	H	
210	1	3-Br-Ph	H	
211	1	4-Br-Ph	H	
212	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
213	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	H	92-94
214	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
215	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	163-165
216	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	
217	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	129-131
218	1	2-OPh-Ph	H	
219	1	3-OPh-Ph	H	
220	1	4-OPh-Ph	H	
221	1	4-tBu-Ph	H	
222	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	
223	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	
224	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
225	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	H	
226	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	H	
227	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
228	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
229	1	α-Naph	H	233-236
230	1	β-Naph	H	
231	1	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	H	

表 8

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
232	2	Ph	H	176-178
233	2	2-CH <sub>3</sub> -Ph	H	208-211
234	2	3-CH <sub>3</sub> -Ph	H	
235	2	4-CH <sub>3</sub> -Ph	H	
236	2	2-F-Ph	H	
237	2	3-F-Ph	H	
238	2	4-F-Ph	H	118-120
239	2	2-Cl-Ph	H	
240	2	3-Cl-Ph	H	
241	2	4-Cl-Ph	H	140-142
242	2	2-Br-Ph	H	
243	2	3-Br-Ph	H	
244	2	4-Br-Ph	H	
245	2	2-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
246	2	3-CF <sub>3</sub> -Ph	H	140-142
247	2	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
248	2	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	
249	2	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	
250	2	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	131-133
251	2	4-tBu-Ph	H	
252	2	2-OPh-Ph	H	
253	2	3-OPh-Ph	H	
254	2	4-OPh-Ph	H	
255	2	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	
256	2	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	
257	2	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
258	2	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	H	
259	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	H	
260	2	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
261	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
262	2	α-Naph	H	215-218
263	2	β-Naph	H	
264	2	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	H	

表 9

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
265	1	Ph	2-Cl	
266	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
267	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
268	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
269	1	2-F-Ph	2-Cl	
270	1	3-F-Ph	2-Cl	
271	1	4-F-Ph	2-Cl	
272	1	2-Cl-Ph	2-Cl	
273	1	3-Cl-Ph	2-Cl	
274	1	4-Cl-Ph	2-Cl	
275	1	2-Br-Ph	2-Cl	
276	1	3-Br-Ph	2-Cl	
277	1	4-Br-Ph	2-Cl	
278	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
279	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
280	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
281	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
282	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
283	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
284	1	4-tBu-Ph	2-Cl	
285	1	2-OPh-Ph	2-Cl	
286	1	3-OPh-Ph	2-Cl	
287	1	4-OPh-Ph	2-Cl	
288	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	2-Cl	
289	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	2-Cl	
290	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
291	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	2-Cl	
292	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	2-Cl	
293	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
294	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
295	1	α-Naph	2-Cl	
296	1	β-Naph	2-Cl	
297	1	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	2-Cl	

表 10

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
298	2	Ph	2-Cl	
299	2	2-CH <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
300	2	3-CH <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
301	2	4-CH <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
302	2	2-F-Ph	2-Cl	
303	2	3-F-Ph	2-Cl	
304	2	4-F-Ph	2-Cl	
305	2	2-Cl-Ph	2-Cl	
306	2	3-Cl-Ph	2-Cl	
307	2	4-Cl-Ph	2-Cl	
308	2	2-Br-Ph	2-Cl	
309	2	3-Br-Ph	2-Cl	
310	2	4-Br-Ph	2-Cl	
311	2	2-CF <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
312	2	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
313	2	4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
314	2	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
315	2	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
316	2	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
317	2	4-tBu-Ph	2-Cl	
318	2	2-OPh-Ph	2-Cl	
319	2	3-OPh-Ph	2-Cl	
320	2	4-OPh-Ph	2-Cl	
321	2	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	2-Cl	
322	2	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	2-Cl	
323	2	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
324	2	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	2-Cl	
325	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	2-Cl	
326	2	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
327	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-Cl	
328	2	$\alpha$ -Naph	2-Cl	
329	2	$\beta$ -Naph	2-Cl	
330	2	4-Me <sub>2</sub> Si-Ph	2-Cl	

表 1 1

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
331	1	Ph	3-Cl	
332	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
333	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
334	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
335	1	2-F-Ph	3-Cl	
336	1	3-F-Ph	3-Cl	
337	1	4-F-Ph	3-Cl	
338	1	2-Cl-Ph	3-Cl	
339	1	3-Cl-Ph	3-Cl	
340	1	4-Cl-Ph	3-Cl	
341	1	2-Br-Ph	3-Cl	
342	1	3-Br-Ph	3-Cl	
343	1	4-Br-Ph	3-Cl	
344	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
345	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
346	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
347	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
348	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
349	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
350	1	2-OPh-Ph	3-Cl	
351	1	4-tBu-Ph	3-Cl	
352	1	3-OPh-Ph	3-Cl	
353	1	4-OPh-Ph	3-Cl	
354	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	3-Cl	
355	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	3-Cl	
356	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
357	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	3-Cl	
358	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	3-Cl	
359	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
360	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
361	1	α-Naph	3-Cl	
362	1	β-Naph	3-Cl	
363	1	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	3-Cl	

表 1 2

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
364	2	Ph	3-Cl	
365	2	2-CH <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
366	2	3-CH <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
367	2	4-CH <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
368	2	2-F-Ph	3-Cl	
369	2	3-F-Ph	3-Cl	
370	2	4-F-Ph	3-Cl	
371	2	2-Cl-Ph	3-Cl	
372	2	3-Cl-Ph	3-Cl	
373	2	4-Cl-Ph	3-Cl	
374	2	2-Br-Ph	3-Cl	
375	2	3-Br-Ph	3-Cl	
376	2	4-Br-Ph	3-Cl	
377	2	2-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
378	2	3-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
379	2	4-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
380	2	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
381	2	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
382	2	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
383	2	4-tBu-Ph	3-Cl	
384	2	2-OPh-Ph	3-Cl	
385	2	3-OPh-Ph	3-Cl	
386	2	4-OPh-Ph	3-Cl	
387	2	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	3-Cl	
388	2	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	3-Cl	
389	2	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
390	2	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	3-Cl	
391	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	3-Cl	
392	2	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
393	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	3-Cl	
394	2	α-Naph	3-Cl	
395	2	β-Naph	3-Cl	
396	2	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	3-Cl	

表 1 3

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
397	1	Ph	4-Cl	
398	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
399	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
400	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
401	1	2-F-Ph	4-Cl	
402	1	3-F-Ph	4-Cl	
403	1	4-F-Ph	4-Cl	
404	1	2-Cl-Ph	4-Cl	
405	1	3-Cl-Ph	4-Cl	
406	1	4-Cl-Ph	4-Cl	
407	1	2-Br-Ph	4-Cl	
408	1	3-Br-Ph	4-Cl	
409	1	4-Br-Ph	4-Cl	
410	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
411	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
412	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
413	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
414	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
415	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
416	1	4-tBu-Ph	4-Cl	
417	1	2-OPh-Ph	4-Cl	
418	1	3-OPh-Ph	4-Cl	
419	1	4-OPh-Ph	4-Cl	
420	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-Cl	
421	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-Cl	
422	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
423	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	4-Cl	
424	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	4-Cl	
425	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
426	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
427	1	α-Naph	4-Cl	
428	1	β-Naph	4-Cl	
429	1	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	4-Cl	

表 1 4

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
430	2	Ph	4-Cl	
431	2	2-CH <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
432	2	3-CH <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
433	2	4-CH <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
434	2	2-F-Ph	4-Cl	
435	2	3-F-Ph	4-Cl	
436	2	4-F-Ph	4-Cl	
437	2	2-Cl-Ph	4-Cl	
438	2	3-Cl-Ph	4-Cl	
439	2	4-Cl-Ph	4-Cl	
440	2	2-Br-Ph	4-Cl	
441	2	3-Br-Ph	4-Cl	
442	2	4-Br-Ph	4-Cl	
443	2	2-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
444	2	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
445	2	4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
446	2	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
447	2	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
448	2	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
449	2	4-tBu-Ph	4-Cl	
450	2	2-OPh-Ph	4-Cl	
451	2	3-OPh-Ph	4-Cl	
452	2	4-OPh-Ph	4-Cl	
453	2	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-Cl	
454	2	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-Cl	
455	2	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
456	2	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	4-Cl	
457	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	4-Cl	
458	2	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
459	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Cl	
460	2	α-Naph	4-Cl	
461	2	β-Naph	4-Cl	
462	2	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	4-Cl	

表 1 5

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
463	1	Ph	4-CF <sub>3</sub>	
464	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
465	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
466	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
467	1	2-F-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
468	1	3-F-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
469	1	4-F-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
470	1	2-Cl-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
471	1	3-Cl-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
472	1	4-Cl-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
473	1	2-Br-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
474	1	3-Br-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
475	1	4-Br-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
476	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
477	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
478	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
479	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
480	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
481	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
482	1	4-tBu-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
483	1	2-OPh-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
484	1	3-OPh-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
485	1	4-OPh-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
486	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
487	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
488	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
489	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
490	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
491	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
492	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
493	1	α-Naph	4-CF <sub>3</sub>	
494	1	β-Naph	4-CF <sub>3</sub>	
495	1	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	4-CF <sub>3</sub>	

表 1 6

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
496	2	Ph	4-CF <sub>3</sub>	
497	2	2-CH <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
498	2	3-CH <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
499	2	4-CH <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
500	2	2-F-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
501	2	3-F-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
502	2	4-F-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
503	2	2-Cl-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
504	2	3-Cl-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
505	2	4-Cl-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
506	2	2-Br-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
507	2	3-Br-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
508	2	4-Br-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
509	2	2-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
510	2	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
511	2	4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
512	2	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
513	2	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
514	2	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
515	2	4-tBu-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
516	2	2-OPh-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
517	2	3-OPh-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
518	2	4-OPh-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
519	2	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
520	2	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
521	2	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
522	2	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
523	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	4-CF <sub>3</sub>	
524	2	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
525	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-CF <sub>3</sub>	
526	2	α-Naph	4-CF <sub>3</sub>	
527	2	β-Naph	4-CF <sub>3</sub>	
528	2	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	4-CF <sub>3</sub>	

表 1 7

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
529	1	Ph	5-CF <sub>3</sub>	
530	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
531	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
532	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
533	1	2-F-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
534	1	3-F-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
535	1	4-F-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
536	1	2-Cl-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
537	1	3-Cl-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
538	1	4-Cl-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
539	1	2-Br-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
540	1	3-Br-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
541	1	4-Br-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
542	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
543	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
544	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
545	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
546	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
547	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
548	1	4-tBu-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
549	1	2-OPh-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
550	1	3-OPh-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
551	1	4-OPh-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
552	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
553	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
554	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
555	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
556	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
557	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
558	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
559	1	$\alpha$ -Naph	5-CF <sub>3</sub>	
560	1	$\beta$ -Naph	5-CF <sub>3</sub>	
561	1	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	5-CF <sub>3</sub>	

表 18

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
562	2	Ph	5-CF <sub>3</sub>	
563	2	2-CH <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
564	2	3-CH <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
565	2	4-CH <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
566	2	2-F-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
567	2	3-F-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
568	2	4-F-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
569	2	2-Cl-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
570	2	3-Cl-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
571	2	4-Cl-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
572	2	2-Br-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
573	2	3-Br-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
574	2	4-Br-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
575	2	2-CF <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
576	2	3-CF <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
577	2	4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
578	2	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
579	2	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
580	2	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
581	2	4-tBu-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
582	2	2-OPh-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
583	2	3-OPh-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
584	2	4-OPh-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
585	2	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
586	2	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
587	2	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
588	2	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
589	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	5-CF <sub>3</sub>	
590	2	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
591	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-CF <sub>3</sub>	
592	2	α-Naph	5-CF <sub>3</sub>	
593	2	β-Naph	5-CF <sub>3</sub>	
594	2	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	5-CF <sub>3</sub>	

表 1 9

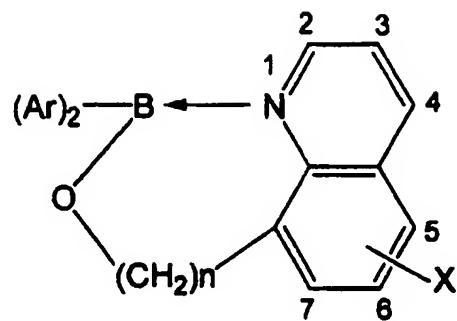
化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
628	1	Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
629	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
630	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
631	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
632	1	2-F-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
633	1	3-F-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
634	1	4-F-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
635	1	2-Cl-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
636	1	3-Cl-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
637	1	4-Cl-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
638	1	2-Br-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
639	1	3-Br-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
640	1	4-Br-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
641	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
642	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
643	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
644	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
645	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
646	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
647	1	4-tBu-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
648	1	2-OPh-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
649	1	3-OPh-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
650	1	4-OPh-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
651	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
652	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
653	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
654	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
655	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
656	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
657	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
658	1	α-Naph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
659	1	β-Naph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
660	1	4-Me <sub>2</sub> Si-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	

表 20

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
661	2	Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
662	2	2-CH <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
663	2	3-CH <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
664	2	4-CH <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
665	2	2-F-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
666	2	3-F-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
667	2	4-F-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
668	2	2-Cl-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
669	2	3-Cl-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
670	2	4-Cl-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
671	2	2-Br-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
672	2	3-Br-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
673	2	4-Br-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
674	2	2-CF <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
675	2	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
676	2	4-CF <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
677	2	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
678	2	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
679	2	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
680	2	4-tBu-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
681	2	2-OPh-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
682	2	3-OPh-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
683	2	4-OPh-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
684	2	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
685	2	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
686	2	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
687	2	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
688	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
689	2	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
690	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
691	2	α-Naph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
692	2	β-Naph	2,4-Cl <sub>2</sub>	
693	2	4-Me <sub>2</sub> Si-Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>	

以下の実施例 7 ~ 9 は下記式で示される化合物に関する :

69

**実施例 7**

化合物 697 (式中、nは0、Arは4-メチルフェニル、Xは水素) の合成

5 ジ(4-メチル)-1-フェニルボロン酸エタノールアミンエステル3.04g (0.012mol) と 8-オキシキノリン2.61g (0.018mol) を化合物1の合成法と同様に反応、処理し白色結晶の化合物697を3.28g (収率81%) 得た。

融点：203～205°C

**実施例 8**

化合物708 (式中、nは0、Arは3-トリフルオロメチルフェニル、Xは水素) の合成

15 ジ(3-トリフルオロメチル)-1-フェニルボロン酸エタノールアミンエステル2.77g (0.012mol) と 8-オキシキノリン2.61g (0.018mol) を化合物1の合成法と同様に反応、処理し白色結晶の化合物708を4.31g (収率80.8%) 得た。

融点：130～132°C

**実施例 9**

化合物724 (式中、nは0、Arはα-ナフチル、Xは水素) の合成

20 ジ-α-ナフチルボロン酸エタノールアミンエステル3.90g (0.012mol) と 8-オキシキノリン2.61g (0.018mol) を化合物1の合成法と同様に反応、処理し白色結晶の化合物724を4.11g (収率86.3%) 得た。

融点：225～226°C

上記実施例 7～9 を参考にすれば、以下の表 21～32 中に示される化合物を  
製することができる。

表 21

5

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
694	0	Ph	H	206-207
695	0	2-CH <sub>3</sub> -Ph	H	189-191
696	0	3-CH <sub>3</sub> -Ph	H	165-167
697	0	4-CH <sub>3</sub> -Ph	H	203-205
698	0	2-F-Ph	H	
699	0	3-F-Ph	H	
700	0	4-F-Ph	H	167-169
701	0	2-Cl-Ph	H	
702	0	3-Cl-Ph	H	
703	0	4-Cl-Ph	H	181-182
704	0	2-Br-Ph	H	
705	0	3-Br-Ph	H	
706	0	4-Br-Ph	H	
707	0	2-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
708	0	3-CF <sub>3</sub> -Ph	H	130-132
709	0	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
710	0	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	199-200
711	0	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	
712	0	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	212-214
713	0	4-tBu-Ph	H	
714	0	2-OPh-Ph	H	
715	0	3-OPh-Ph	H	
716	0	4-OPh-Ph	H	
717	0	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	
718	0	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	
719	0	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
720	0	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	H	
721	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	H	
722	0	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
723	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
724	0	α-Naph	H	225-226
725	0	β-Naph	H	
726	0	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	H	

表 2 2

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
727	1	Ph	H	
728	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	H	
729	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	H	
730	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	H	
731	1	2-F-Ph	H	
732	1	3-F-Ph	H	
733	1	4-F-Ph	H	
734	1	2-Cl-Ph	H	
735	1	3-Cl-Ph	H	
736	1	4-Cl-Ph	H	
737	1	2-Br-Ph	H	
738	1	3-Br-Ph	H	
739	1	4-Br-Ph	H	
740	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
741	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
742	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
743	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	
744	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	
745	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	H	
746	1	4-tBu-Ph	H	
747	1	2-OPh-Ph	H	
748	1	3-OPh-Ph	H	
749	1	4-OPh-Ph	H	
750	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	
751	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H	
752	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
753	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	H	
754	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	H	
755	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
756	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	
757	1	α-Naph	H	
758	1	β-Naph	H	
759	1	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	H	

表 2 3

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
760	0	Ph	5-Cl	
761	0	2-CH <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
762	0	3-CH <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
763	0	4-CH <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
764	0	2-F-Ph	5-Cl	
765	0	3-F-Ph	5-Cl	
766	0	4-F-Ph	5-Cl	
767	0	2-Cl-Ph	5-Cl	
768	0	3-Cl-Ph	5-Cl	
769	0	4-Cl-Ph	5-Cl	
770	0	2-Br-Ph	5-Cl	
771	0	3-Br-Ph	5-Cl	
772	0	4-Br-Ph	5-Cl	
773	0	2-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
774	0	3-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
775	0	4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
776	0	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
777	0	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
778	0	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
779	0	4-tBu-Ph	5-Cl	
780	0	2-OPh-Ph	5-Cl	
781	0	3-OPh-Ph	5-Cl	
782	0	4-OPh-Ph	5-Cl	
783	0	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-Cl	
784	0	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-Cl	
785	0	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
786	0	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	5-Cl	
787	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	5-Cl	
788	0	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
789	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
790	0	α-Naph	5-Cl	
791	0	β-Naph	5-Cl	
792	0	4-Me <sub>2</sub> Si-Ph	5-Cl	

表 2 4

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
793	1	Ph	5-Cl	
794	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
795	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
796	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
797	1	2-F-Ph	5-Cl	
798	1	3-F-Ph	5-Cl	
799	1	4-F-Ph	5-Cl	
800	1	2-Cl-Ph	5-Cl	
801	1	3-Cl-Ph	5-Cl	
802	1	4-Cl-Ph	5-Cl	
803	1	2-Br-Ph	5-Cl	
804	1	3-Br-Ph	5-Cl	
805	1	4-Br-Ph	5-Cl	
806	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
807	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
808	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
809	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
810	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
811	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
812	1	4-tBu-Ph	5-Cl	
813	1	2-OPh-Ph	5-Cl	
814	1	3-OPh-Ph	5-Cl	
815	1	4-OPh-Ph	5-Cl	
816	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-Cl	
817	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-Cl	
818	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
819	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	5-Cl	
820	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	5-Cl	
821	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
822	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Cl	
823	1	α-Naph	5-Cl	
824	1	β-Naph	5-Cl	
825	1	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	5-Cl	

表 2 5

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
826	0	Ph	7-Cl	
827	0	2-CH <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
828	0	3-CH <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
829	0	4-CH <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
830	0	2-F-Ph	7-Cl	
831	0	3-F-Ph	7-Cl	
832	0	4-F-Ph	7-Cl	
833	0	2-Cl-Ph	7-Cl	
834	0	3-Cl-Ph	7-Cl	
835	0	4-Cl-Ph	7-Cl	
836	0	2-Br-Ph	7-Cl	
837	0	3-Br-Ph	7-Cl	
838	0	4-Br-Ph	7-Cl	
839	0	2-CF <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
840	0	3-CF <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
841	0	4-CF <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
842	0	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
843	0	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
844	0	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
845	0	4-tBu-Ph	7-Cl	
846	0	2-OPh-Ph	7-Cl	
847	0	3-OPh-Ph	7-Cl	
848	0	4-OPh-Ph	7-Cl	
849	0	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	7-Cl	
850	0	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	7-Cl	
851	0	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
852	0	2-CF <sub>3</sub> ,3,4-Cl-Ph	7-Cl	
853	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	7-Cl	
854	0	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
855	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
856	0	α-Naph	7-Cl	
857	0	β-Naph	7-Cl	
858	0	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	7-Cl	

表 2 6

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
859	1	Ph	7-Cl	
860	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
861	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
862	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
863	1	2-F-Ph	7-Cl	
864	1	3-F-Ph	7-Cl	
865	1	4-F-Ph	7-Cl	
866	1	2-Cl-Ph	7-Cl	
867	1	3-Cl-Ph	7-Cl	
868	1	4-Cl-Ph	7-Cl	
869	1	2-Br-Ph	7-Cl	
870	1	3-Br-Ph	7-Cl	
871	1	4-Br-Ph	7-Cl	
872	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
873	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
874	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
875	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
876	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
877	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
878	1	4-tBu-Ph	7-Cl	
879	1	2-OPh-Ph	7-Cl	
880	1	3-OPh-Ph	7-Cl	
881	1	4-OPh-Ph	7-Cl	
882	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	7-Cl	
883	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	7-Cl	
884	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
885	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	7-Cl	
886	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	7-Cl	
887	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
888	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	7-Cl	
889	1	$\alpha$ -Naph	7-Cl	
890	1	$\beta$ -Naph	7-Cl	
891	1	4-Me <sub>2</sub> Si-Ph	7-Cl	

表 2 7

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
892	0	Ph	2-CH <sub>3</sub>	
893	0	2-CH <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
894	0	3-CH <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
895	0	4-CH <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
896	0	2-F-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
897	0	3-F-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
898	0	4-F-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
899	0	2-Cl-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
900	0	3-Cl-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
901	0	4-Cl-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
902	0	2-Br-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
903	0	3-Br-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
904	0	4-Br-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
905	0	2-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
906	0	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
907	0	4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
908	0	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
909	0	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
910	0	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
911	0	4-tBu-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
912	0	2-OPh-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
913	0	3-OPh-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
914	0	4-OPh-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
915	0	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
916	0	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
917	0	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
918	0	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
919	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
920	0	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
921	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
922	0	α-Naph	2-CH <sub>3</sub>	
923	0	β-Naph	2-CH <sub>3</sub>	
924	0	4-Me <sub>2</sub> Si-Ph	2-CH <sub>3</sub>	

表2 8

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
925	2	Ph	2-CH <sub>3</sub>	
926	2	2-CH <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
927	2	3-CH <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
928	2	4-CH <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
929	2	2-F-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
930	2	3-F-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
931	2	4-F-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
932	2	2-Cl-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
933	2	3-Cl-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
934	2	4-Cl-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
935	2	2-Br-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
936	2	3-Br-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
937	2	4-Br-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
938	2	2-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
939	2	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
940	2	4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
941	2	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
942	2	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
943	2	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
944	2	4-tBu-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
945	2	2-OPh-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
946	2	3-OPh-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
947	2	4-OPh-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
948	2	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
949	2	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
950	2	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
951	2	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
952	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	2-CH <sub>3</sub>	
953	2	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
954	2	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	2-CH <sub>3</sub>	
955	2	α-Naph	2-CH <sub>3</sub>	
956	2	β-Naph	2-CH <sub>3</sub>	
957	2	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	2-CH <sub>3</sub>	

表 2 9

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
958	0	Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
959	0	2-CH <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
960	0	3-CH <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
961	0	4-CH <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
962	0	2-F-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
963	0	3-F-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
964	0	4-F-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
965	0	2-Cl-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
966	0	3-Cl-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
967	0	4-Cl-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
968	0	2-Br-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
969	0	3-Br-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
970	0	4-Br-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
971	0	2-CF <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
972	0	3-CF <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
973	0	4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
974	0	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
975	0	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
976	0	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
977	0	4-tBu-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
978	0	2-OPh-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
979	0	3-OPh-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
980	0	4-OPh-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
981	0	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
982	0	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
983	0	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
984	0	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
985	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
986	0	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
987	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
988	0	α-Naph	5-SO <sub>3</sub> H	
989	0	β-Naph	5-SO <sub>3</sub> H	
990	0	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	

表 3 O

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
991	0	Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
992	0	2-CH <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
993	0	3-CH <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
994	0	4-CH <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
995	0	2-F-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
996	0	3-F-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
997	0	4-F-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
998	0	2-Cl-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
999	0	3-Cl-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1000	0	4-Cl-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1001	0	2-Br-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1002	0	3-Br-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1003	0	4-Br-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1004	0	2-CF <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1005	0	3-CF <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1006	0	4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1007	0	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1008	0	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1009	0	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1010	0	4-tBu-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1011	0	2-OPh-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1012	0	3-OPh-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1013	0	4-OPh-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1014	0	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1015	0	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1016	0	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1017	0	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1018	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1019	0	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1020	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-SO <sub>3</sub> H	
1021	0	α-Naph	5-SO <sub>3</sub> H	
1022	0	β-Naph	5-SO <sub>3</sub> H	
1023	0	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	5-SO <sub>3</sub> H	

表 3 1

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
1024	0	Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1025	0	2-CH <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1026	0	3-CH <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1027	0	4-CH <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1028	0	2-F-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1029	0	3-F-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1030	0	4-F-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1031	0	2-Cl-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1032	0	3-Cl-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1033	0	4-Cl-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1034	0	2-Br-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1035	0	3-Br-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1036	0	4-Br-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1037	0	2-CF <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1038	0	3-CF <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1039	0	4-CF <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1040	0	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1041	0	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1042	0	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1043	0	4-tBu-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1044	0	2-OPh-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1045	0	3-OPh-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1046	0	4-OPh-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1047	0	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1048	0	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1049	0	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1050	0	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1051	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1052	0	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1053	0	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1054	0	α-Naph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1055	0	β-Naph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1056	0	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	

表 3 2

化合物 No.	n	Ar	X	融点 (°C)
1057	1	Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1058	1	2-CH <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1059	1	3-CH <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1060	1	4-CH <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1061	1	2-F-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1062	1	3-F-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1063	1	4-F-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1064	1	2-Cl-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1065	1	3-Cl-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1066	1	4-Cl-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1067	1	2-Br-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1068	1	3-Br-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1069	1	4-Br-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1070	1	2-CF <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1071	1	3-CF <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1072	1	4-CF <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1073	1	2-OCH <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1074	1	3-OCH <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1075	1	4-OCH <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1076	1	4-tBu-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1077	1	2-OPh-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1078	1	3-OPh-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1079	1	4-OPh-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1080	1	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1081	1	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1082	1	2-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1083	1	2-CF <sub>3</sub> ,3-Cl-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1084	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1085	1	3-Cl,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1086	1	3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> -Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1087	1	α-Naph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1088	1	β-Naph	5,7-Cl <sub>2</sub>	
1089	1	4-Me <sub>3</sub> Si-Ph	5,7-Cl <sub>2</sub>	

本発明化合物は、それぞれの分野でよく知られた方法に従って製剤化して家禽用コクシジウム予防剤および治療剤とすることができます。即ち、本発明の化合物を、単味または通常この種の薬剤に使用される適当な担体と共に、場合により賦形剤、崩壊剤、滑沢剤コーティング等を用いて、散剤、粒剤、溶液、懸濁液、<sup>5</sup> プ

レミックス、カプセル、乳剤、錠剤等の剤型に調製することができる。

本発明の製剤に用いられる担体は通常、家禽の飼料または飲水に添加できるものであれば、特に制限されないが、水、乳糖、ショ糖、タルク、コロイド状シリカ、ペクチン、小麦粉、米ぬか、トウモロコシ粉、大豆、油粕、ひきわり穀粉、  
5 その他市販の家禽用飼料等が例示される。

本発明化合物の投与量は、飼料に添加して使用する場合には、一般に家禽飼料中に、少なくとも原体換算で0.1～500 ppm、好ましくは0.5～100 ppmの濃度になるように配合すればよい。また、飲料水に添加して使用する場合には、飲料水中の本発明化合物の濃度は上記飼料中の濃度の約半分で充分な効  
10 果を示すことができる。

さらに、本発明の化合物は、既知家禽用抗コクシジウム剤、寄生虫駆除剤、感染症予防剤または成長促進剤等を含む動物用医薬品と併用することもできる。

### 試験例

15 以下に示す試験例により、本発明化合物の抗コクシジウム活性を証明した。

本発明の家禽用抗コクシジウム剤のインビトロ (in vitro) 試験は下記のようにして行った。

#### 試験例 1

20 ニワトリ腎臓 (CK) 培養細胞におけるコクシジウムのインビトロ (in vitro) 増殖抑制活性

##### 1. 細胞の処置

25 公知の方法によって SPF ヒナから無菌的に腎臓を採材、トリプシン消化し細胞を洗浄、細胞数を調整後、CO<sub>2</sub> インキュベータで 37°C、72 時間培養し単層細胞を得た。単層細胞に所定濃度に希釈した被検化合物および人工脱殻したアイメリア・テネラのスプロノイトを接種、40°C、48 時間培養した。培養後の細胞は、アルコール固定、ギムザ染色をし、以下観察をした。

##### 2. 観察および判定

倒立顕微鏡下においてニワトリ腎臓細胞質内で分裂、増殖した第 1 代シゾント

(成熟および未成熟)を観察、そのシゾント数から無処理スプロソイト接種対照群に対する原虫の増殖抑制率を求めた。

また、同時に細胞毒性 (CPE) も観察し、(−) ~ (+++) の4段階評価を行つた：−：無処理対照と差なし、+：軽度の変化、++：中度の変化、+++：完全に細胞が脱落 (原虫の観察は不能)。

得られた結果を以下の表33に示す。

### 試験例2

ニワトリヒナにおけるコクシジウム症予防・治療効果のインビボ (in vivo) 判定

本発明化合物のアイメリア・テネラに対する有効性 (抗コクシジウム効果) を200ppmまたは400ppm飼料添加連続投与において検討した。

7～10日令の白色レグホンのヒナ3羽を1群とし、被検化合物を添加した飼料を投与した。投与開始2日目にアイメリア・テネラの胞子形成オーシストを、一羽あたり50,000個感染させた。被検化合物は9日間連続投与し、その間の血便排泄程度、生存率、相対増体率を観察し、感染8日目に剖検して盲腸病変を観察し、盲腸病変値を算出した。

本試験の判定基準は次の通りである。

相対増体率：

試験群の体重増加量÷無感染対照群の体重増加量×100 (%) で表示。

血便の排泄：

試験期間中に排泄される血便の排泄程度を以下の4段階で評価。表中、「d」はオーシスト投与後の日数を表す。

− : 血便排泄を認めない。

+ : 軽度の血便排泄を認める。

++ : 中度の血便排泄を認める。

+++ : 感染対照群と同程度の血便排泄を認める。

盲腸病変値：

メルク (Merck) の検定法による。

生存したヒナを感染8日後に剖検し、盲腸病変を肉眼的に観察し、その病変程度を0～4に分けて（病変なしを0、重度のものを4とし）その間の強度を測定し、5羽分の平均値で表す。

試験結果を、未処置感染対照群および未処置無感染対照群と比較して表33に示す。

表33

Comp.No	in vitro抗原虫活性( <i>E tenella</i> )			in vivo抗コクシジウム効果( <i>E tenella</i> )						
	濃度(μg/ml)			投与量 (ppm in feed)	相対増 体重率 (%)	血便の排泄			致死数 (/)	OPG値
	% (CPE)	% (CPE)	% (CPE)			4	5	6d		
1	<0 (-)	0.2 (-)	<0 (-)							
694	(++)	125(-)	<0 (-)							
199	39.6(-)	<0 (-)	<0 (-)							
232	32.2(-)	0.9(-)	6.0(-)							
31	69.7(-)	0 (-)	<0 (-)	400	66.8	±	+++	++	0/3 (測定せず)	4.0
724	(++)	100 (-)	<0 (-)	400	58.9	±	+++	++	0/3	4.0
229	77.0(-)	<0 (-)	<0 (-)	400	56.5	+	+++	++	0/3	4.0
262	60.4(-)	0.9(-)	<0 (-)	400	53.8	±	+++	+++	0/3	4.0
2	<0 (-)	<0 (-)	<0 (-)							
695	(++)	(++)	<0 (-)	400	61.5	+	+++	+++	0/3	3.7
200	<0 (-)	<0 (-)	<0 (-)							
233	<0 (-)	<0 (-)	<0 (-)							
3	19.3(-)	<0 (-)	<0 (-)							
698	(++)	90.7(+)	30.5(-)	400	61.5	+	+++	++	1/3	4.0
201	71.3(-)	<0 (-)	<0 (-)	400	71.8	+	+++	++	1/3	4.0
4	<0 (-)	<0 (-)	<0 (-)							
697	(++)	65.1(±)	<0 (-)	400	76.9	±	+++	+++	1/3	3.7
202	44.2(-)	<0 (-)	<0 (-)							
710	(++)	<0 (-)	<0 (-)							
215	4.5(-)	<0 (-)	1.8(-)							
19	<0 (-)	<0 (-)	<0 (-)							
712	(++)	28.8(-)	<0 (-)							
217	14.5(-)	<0 (-)	<0 (-)							
250	<0 (-)	2.4(-)	<0 (-)							
703	(++)	<0 (-)	<0 (-)							
208	17.2(-)	<0 (-)	1.8 (-)							
241	14.0(-)	<0 (-)	<0 (-)							
10	100 (+)	121(-)	<0 (-)	400	82.5	-	-	-	0/3	0.0(H)
15	99.6(+)	<0 (-)	<0 (-)	200	25.7	+	+++	++	0/3	4.0
708	(++)	94.7(++)	18.6(-)	400	42.4	+	++	+++	0/3	4.0
213	100 (+)	13.0(-)	<0 (-)	400	57.4	±	++	++	0/3	3.7
246	100 (+)	14.8 (-)	<0 (-)	400	82.5	-	+	++	0/3	3.3(S)
7	<0 (-)	<0 (-)	<0 (-)							
700	(++)	99.8 (++)	30.6(-)							
205	33.2(±)	<0 (-)	<0 (-)							
238	27.1(±)	<0 (-)	<0 (-)							

結果： 化合物10および化合物246等に明らかな臨床症状、相対増体率およ

び盲腸病変値等の改善が認められた。特に、化合物10は血便の排泄を全く認めず盲腸も正常で感染の所見を全く認めなった。

### 試験例3

#### 5 化合物10についてのさらなるインビボ (in vivo) 試験

試験例1および2により良好な成績を示した化合物10について、さらに詳細にインビボ試験を行った。

即ち、試験例2と同様の手法により、化合物10のブロイラーヒナにおけるアイメリア・テネラおよびアイメリア・アセルブリーナに対する有効性を調べた。

10 なお、ここでは感染6日目の糞便1g当たりに存在するオーシスト数であるOPG値も測定した。OPG値の測定方法は、糞便を採取しよく混和し、その2gを蒸留水を用いて20倍に希釈し、フックスローゼンタール計算盤を用いてカウントし、単位g当たりのOPG値を算出した。OPG値はその多少によってその後の感染の程度がある程度推定できる。OPG値が高くなるに従いより重篤な症  
15 状となるのが一般である。

得られた結果を表34および表35に示す。

表34

アイメリア・テネラに対する抗コクシジウム効果 (ブロイラー)

Comp.No	投与量 (ppm in feed)	相対増体率 (-1~8d) %	血便の排泄				死因数 (/)	OPG値 6d	盲腸 病変値 (8d)	判定
			4	5	6	7d				
化合物10	200	70.2(T)	-	-	-	-	0/3	0	0	○(T)*
	100	101.0	-	+	+	±	0/3	1.0x10 <sup>5</sup>	6.3x10 <sup>3</sup>	1.7*
	50	54.8	+	+++	++	+	0/3	2.9x10 <sup>5</sup>	9.8x10 <sup>4</sup>	4.0
	25	65.0	+	+++	++	-	0/3	1.3x10 <sup>5</sup>	4.3x10 <sup>4</sup>	4.0
感染対照	0	49.0	++	+++	++	±	1/3	1.9x10 <sup>5</sup>	1.3x10 <sup>5</sup>	4.0
正常対照	0	100	-	-	-	-	0/3	0	0	0

\* 下痢症状(+)

表 3 5

## アイメリア・アセルブリーナに対する抗コクシジウム効果（ブロイラーヒナ）

Comp.No	投与量 (ppm in feed)	相対増体率 (-1~5d) %	粘液便の排泄			死亡数 (/)	OPG値	判定 (×～◎)
			3	4	5d			
化合物10	200	82.3(T)	-	-	-	0/3	0	0 ◎(T)*
	100	80.6	-	+	++	0/3	$8.6 \times 10^6$	$2.8 \times 10^6$ △ *
	50	87.8	-	++	+++	0/3	$5.9 \times 10^6$	$1.7 \times 10^6$ ×
	25	51.8	-	++	+++	0/3	$1.9 \times 10^7$	$6.2 \times 10^6$ ×
感染対照	0	54.9	-	++	+++	0/3	$1.7 \times 10^7$	$7.5 \times 10^6$
正常対照	0	100	-	-	-	0/3	0	0

\* 下痢症状(+)

5 結果：アイメリア・テネラおよびアイメリア・アセルブリーナ両種に対して飼料中100ppm投与で明らかな臨床症状、相対増体率および盲腸病変値（アイメリア・テネラのみ）の改善が認められ、化合物10が優れた抗コクシジウム効果を有することが確認された。

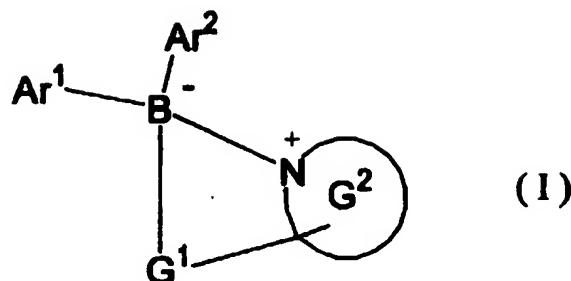
発明の効果

10 本発明化合物は、上記試験例から明らかなように、コクシジウムを感染させたニワトリヒナにおいて、相対増体率減少の抑制、血便排泄の抑制、オーシスト個数（O. P. G.）の減少および盲腸病変値の改善等の強い抗コクシジム活性を示す。また、本発明化合物は、死亡個体のデータからも明らかに低毒性であるので、ニワトリをはじめ、七面鳥、アヒル等の家禽類およびウシ、ブタ等の家畜類のコクシジウム症に対する予防および治療剤として有用である。

15

## 請求の範囲

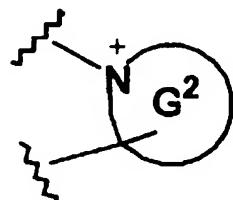
1. 一般式 (I) :



5 [式中、 $\text{Ar}^1$ および $\text{Ar}^2$ はそれぞれ独立して、置換されていてもよい環式基；

10  $\text{G}^1$ は、式： $-\text{A}-$ 、 $-\text{A}-\text{CR}^1\text{R}^2-$ または $-\text{A}-\text{CR}^3\text{R}^4-\text{CR}^5\text{R}^6-$ で表される基（式中、 $\text{A}$ は酸素原子または硫黄原子、 $\text{R}^1$ ～ $\text{R}^6$ はそれぞれ同一または異なって水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、置換されていてもよい脂肪族炭化水素基、 $-\text{O}-$ （置換されていてもよい脂肪族炭化水素基）、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または $\text{R}^1$ と $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^3$ と $\text{R}^4$ および／もしくは $\text{R}^5$ と $\text{R}^6$ が一緒になってオキソ、置換されていてもよいメチレンもしくは置換されていてもよいイミノを形成する）；

式：



で示される基は置換されていてもよいアザ環式基；

20 ただし、 $\text{B}^-$ 、 $\text{G}^1$ および $\text{G}^2$ から構成される環のうち最小環は5員環または6員環であるものとする]

で表わされる化合物もしくはその塩またはそれらの水和物を含有する動物（ヒト

を除く) 用医薬組成物。

2. 一般式 (I) 中、 $A_r^{r1}$  および  $A_r^{r2}$  が同一であり、ともに置換されていてもよいアリール基である請求項 1 記載の医薬組成物。

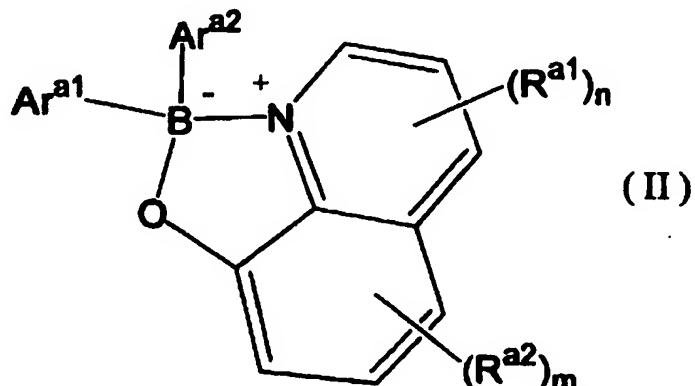
3. 一般式 (I) 中、 $G^1$  が式:  $-O-$ 、 $-O-CR^1R^2-$  または  $-O-CR^3R^4-CR^5R^6-$  で表される基 (式中、 $R^1$  ~  $R^6$  はそれぞれ同一または異なつて水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよい低級アルケニル基、置換されていてもよい低級アルキルオキシ基、または置換されていてもよい低級アルケニルオキシ基) である請求項 1 または 2 記載の医薬組成物。

4. 一般式 (I) [式中、各記号の定義は請求項 1 と同義] で表される化合物もしくはその塩またはそれらの水和物を含有する抗原虫剤。

5. 一般式 (I) [式中、各記号の定義は請求項 1 と同義] で表される化合物もしくはその塩またはそれらの水和物を含有する抗コクシジウム剤。

6. 一般式 (II) :

15



[式中、 $A_r^{r1}$  は、置換されていてもよいアリール基；

$A_r^{r2}$  は置換されていてもよい縮合アリール基；

20

$R^{a1}$  および  $R^{a2}$  はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシリルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換され

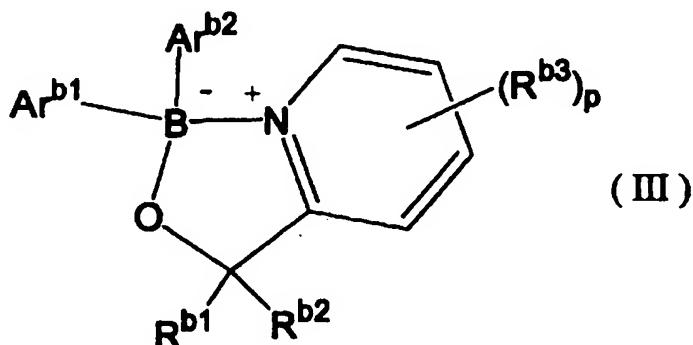
ていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、または置換されていてもよいアリール基；

$n$  および  $m$  は同一または異なって  $0 \sim 3$  のいずれかの整数を示す。

ただし、 $n$  および  $m$  がともに 0 であるとき、 $A r^{b1}$  および  $A r^{b2}$  がともに 1 位がナフタレンー 1-イルで置換されているナフタレンー 2-イルである場合を除く。]

で表わされる化合物もしくはその塩またはそれらの水和物。

### 7. 一般式 (III) :



[式中、 $A r^{b1}$  および  $A r^{b2}$  は同一または異なって置換されていてもよいアリール基；

$R^{b1}$  および  $R^{b2}$  はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシリルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または  $R^{b1}$  と  $R^{b2}$  が一緒になってオキソ、置換されていてもよいメチレンもしくは置換されていてもよいイミノを形成する；

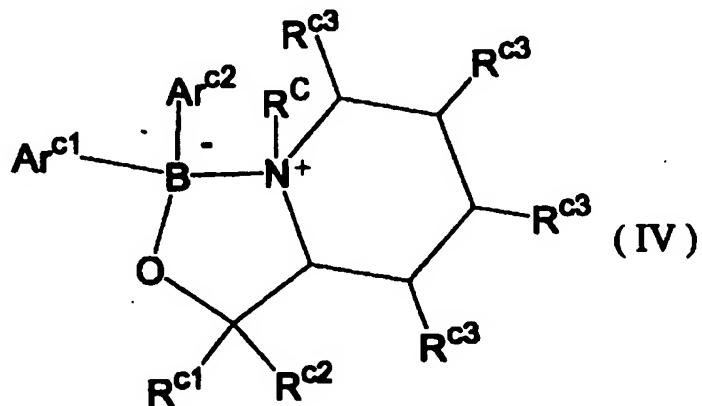
$R^{b3}$  はそれぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ

基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシリ  
オキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキ  
ルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、ま  
たは置換されていてもよいアリール基であるか、または隣接する基と一緒にになっ  
て縮合環を形成していてもよい；  
5

pは0～4のいずれかの整数を示す。

ただし、pが0、R<sup>b1</sup>およびR<sup>b2</sup>がともに水素ならびにAr<sup>b1</sup>およびAr<sup>b2</sup>  
がハロゲン原子または低級アルキル基によって置換されているフェニルであると  
き、Ar<sup>b1</sup>およびAr<sup>b2</sup>における該フェニルはハロゲン原子および低級アルキ  
10 ル基以外の置換基によってさらに置換されているものとする。]  
で表わされる化合物もしくはその塩またはそれらの水和物。

#### 8. 一般式 (IV) :



[式中、Ar<sup>c1</sup>およびAr<sup>c2</sup>はそれぞれ独立して、置換されていてもよい環式  
15 基；

R<sup>c1</sup>およびR<sup>c2</sup>はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキ  
ル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニ  
ル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、  
20 低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケ  
ニルオキシ基、アシリルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換され  
ていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されてい  
てもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または

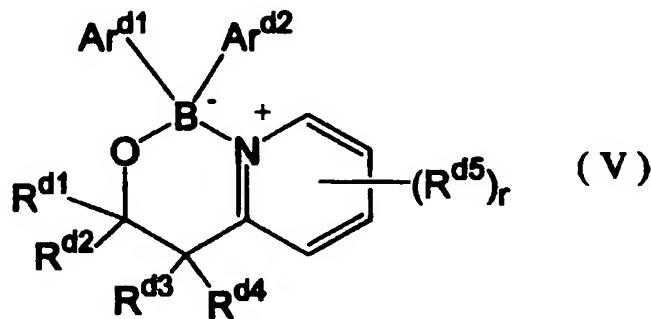
$R^{d1}$ と $R^{d2}$ が一緒になってオキソ、置換されていてもよいメチレンもしくは置換されていてもよいイミノを形成する；

$R^{d3}$ はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシリルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または隣接する基と一緒にになって縮合環を形成していてもよい；

[ $R^d$ は水素原子または低級アルキルを示す]

で表わされる化合物もしくはその塩またはそれらの水和物。

#### 9. 一般式 (V) :



[式中、 $Ar^{d1}$ および $Ar^{d2}$ は同一または異なって置換されていてもよいアリール基；

$R^{d1}$ 、 $R^{d2}$ 、 $R^{d3}$ および $R^{d4}$ はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシリルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または $R^{d1}$ と $R^{d2}$ および/または $R^{d3}$ と $R^{d4}$ が一緒になってオキソ、置換され

ていてもよいメチレンもしくは置換されていてもよいイミノを形成する；

R<sup>d5</sup>はそれぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシリオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または隣接する基と一緒にになって縮合環を形成していてもよい；

10 r は0～4のいずれかの整数を示す。

ただし、r が0、R<sup>d1</sup>、R<sup>d2</sup>、R<sup>d3</sup>およびR<sup>d4</sup>がすべて水素ならびにA<sub>r</sub><sup>d1</sup>およびA<sub>r</sub><sup>d2</sup>がハロゲン原子または低級アルキル基によって置換されているフェニルであるとき、A<sub>r</sub><sup>d1</sup>およびA<sub>r</sub><sup>d2</sup>における該フェニルはハロゲン原子および低級アルキル基以外の置換基によってさらに置換されているものとする。] 15 で表わされる化合物もしくはその塩またはそれらの水和物。

10. 請求項6から9までのいずれかに記載の化合物を含有する動物（ヒトを除く）用医薬組成物。

11. 請求項6から9までのいずれかに記載の化合物を含有する抗原虫剤。

12. 請求項6から9までのいずれかに記載の化合物を含有する抗コクシジウム剤。

20

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP99/07139

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl' A61K31/69, A61P33/02, C07F5/02

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl' A61K31/69, A61P33/02, C07F5/02

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)  
CAPLUS (STN), REGISTRY (STN), MEDLINE (STN), EMBASE (STN)

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X Y	TRUJILLO, Jose et al. X-ray crystallographic study of boroxazolidones obtained from L-ornithine, L-methionine, kainic acid and 2,6-pyridinedicarboxylic acid, J. Organomet. Chem., 1998, Vol.571, No.1, pp.21-29, especially, page 22	7, 8 1-5, 10-12
X Y	HOPFL, Herbert et al, Study of cyclic borinates obtained from piperidine- and piperazine alcohols by spectroscopic methods and X-ray crystallography, J. Organomet. Chem., 1998, Vol.553, No.1-2, pp.221-239, especially, pages 222, 227	8 1-5, 10-12
X Y	DOROKHOV, V.A. et al, Boron chelate complexes with some enaminones and diketones containing pyridine moiety and their mutual transformation in solutions, Izv. Akad. Nauk, Ser. Khim., 1996, No.3, pp.710-714, especially, page 712	7 1-5, 10-12
X Y	Yuan, Guo-Zheng et al, Single site transarylation of 2,2'-dimetalized 1,1'-binaphthyl to aminochloroborates and synthesis of 2-binaphthyl boron compounds, Youji Huaxue, 1996, Vol.16, No.2, pp.139-144, especially, pages 139, 140	6 1-5, 10-12

 Further documents are listed in the continuation of Box C.  See patent family annex.

° Special categories of cited documents:	"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance	"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"E" earlier document but published on or after the international filing date	"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)	"&" document member of the same patent family
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means	
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed	

Date of the actual completion of the international search  
22 February, 2000 (22.02.00)Date of mailing of the international search report  
29 February, 2000 (29.02.00)Name and mailing address of the ISA/  
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP99/07139

## C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X Y	US, 5348947, A (PATEL,Bomi P.), 20 September, 1994 (20.09.94) (Family: none) the whole document	7 1-5,10-12
X Y	US, 5348947, A (PATEL,Bomi P.), 20 September, 1994 (20.09.94) (Family: none) the whole document	7 1-5,10-12
X Y	TORRES,Luis Alfonso et al, Rotating-bomb combustion calorimetry and the standard enthalpies of formation of two borinic esters, J. Chem. Thermodyn. Vol.1994, No.26, No.4, pp.337-43, especially, page 338	7,9 1-5,10-12
X Y	FARFAN,Norberto et al, Through-bond modulation of N .fwdarw.B ring formation shown by NMR and x-ray diffraction studies of borate derivatives of pyridyl alcohols, J. Chem. Soc., Perkin Trans. 2, 1992, No.4, pp.527-32, especially, page 527	7,9 1-5,10-12
X Y	LIU,Xiaolan et al, Structure studies of bis (substituted)-2-(substituted)-8-hydroxyquinolines, Youji Huaxue, 1991, Vol.11, No.4, pp.410-15, especially, pages 412, 414	6 1-5,10-12
X Y	SHAN,Zixing et al, Synthesis of aromatic nitrogen-containingheterocyclic derivatives of asymmetric diarylborinic acids, Wuhan Daxue Xuebao, Ziran Kexueban, 1990, No.3, pp.67-72, especially, page 68	6,7 1-5,10-12
X Y	YUAN,Guozheng et al, Ligand substitution reaction of diarylboron chelates, Wuji Huaxue Xuebao, 1990, Vol.6, No.3, pp.314-18, especially, pages 314,315	6 1-5,10-12
X Y	YUAN,Guozheng et al, Studies on antitumor boron compounds. V. Fluorine- and methoxy-substituted diphenylboron chelates with N,O-bidentate ligands, Youji Huaxue, 1989, Vol.9, No.3, pp.226-9, especially, page 227	6 1-5,10-12
X Y	YUAN,Guozheng et al, Boron compounds. XX. Synthesis and conversion of ethanolamine-tri(2-furyl)borane, Youji Huaxue 1987, No.2, pp.146-9, especially, page 148	6 1-5,10-12
X Y	MOEHRLE,H.et al, Concurrent reaction of the phenol and the 1,3-dicarbonyl function under Mannich conditions, Pharmazie,1985, Vol.40, No.11, pp.767-71, especially, Page 767	6 1-5,10-12
X Y	MOEHRLE,H.et al, Reaction of functional epoxycarbonyl compounds opposed to hydrogen chloride, Pharmazie, 1985, Vol.40, No.6, pp.387-93, especially, page 389	6 1-5,10-12
X Y	MOEHRLE,H.et al, Real structures of drugs seemingly derivedfrom - (8-hydroxyquinol-5-yl)-3-phenylpropane-1, 3-dione, Pharmazie, 1985, Vol.40, No.5, pp.307-11, especially, page 309	6 1-5,10-12
X Y	LIN,Kai et al, Synthesis and antitumor activity of organyloxy-diarylborane chelates containing quinoline ring, Yiyao Gongye, 1985, Vol.16, No.11, pp.500-2, especially, page 501	6 1-5,10-12

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP99/07139

## C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X Y	BAILEY, P.J. et al, Boron-containing antibacterial agents: effects on growth and morphology of bacteria under various culture conditions, <i>Antimicrob. Agents Chemother.</i> , 1980, Vol.17, No.4, pp.549-53, especially, Fig.1	6 1-5,10-12
X Y	MOEHRLE, H. et al, Conformation influences during the dehydrogenation of phenolic Mannich bases, <i>Monatsh. Chem.</i> , 1974, Vol.105, No.6, pp.1151-63, especially, page 1156	6 1-5,10-12
X Y	TITKOV, Yu.B. et al, Luminescence method for determining molybdenum with hydroxyquinoline and sodium tetraphenylborate, <i>Ukr. Khim. Zh.</i> , 1970, Vol.36, No.6, pp.613-15, especially, page 614	6 1-5,10-12
X Y	DOUGLASS, James E. et al, Some bis-amine complexes of boroniumions with bulky substituents of boron, <i>J. Organomet. Chem.</i> , 1967, Vol.8, No.3, pp.421-6, especially, page 421	6 1-5,10-12
X Y	DE, 1670494, A (Chemie Grünenthal GmbH), 21 January, 1971 (21.01.71) (Family: none) page 2, line 6 to page 4	1-12
X Y	EP, 969531, A2 (Bayer Aktiengesellschaft), 05 January, 2000 (05.01.00), Par. Nos. [0046] to [0079]; Claim 10 & DE, 19829947, A1	6

## A. 発明の属する分野の分類(国際特許分類(IPC))

Int. Cl' A61K31/69, A61P33/02, C07F5/02

## B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料(国際特許分類(IPC))

Int. Cl' A61K31/69, A61P33/02, C07F5/02

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース(データベースの名称、調査に使用した用語)

CAPLUS(STN), REGISTRY(STN), MEDLINE(STN), EMBASE(STN)

## C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X Y	TRUJILLO, Jose et al. X-ray crystallographic study of boroxazolidones obtained from L-ornithine, L-methionine, kainic acid and 2,6-pyridinedicarboxylic acid. J. Organomet. Chem., 1998, Vol. 571, No. 1, pp. 21-29, 特に、第22ページ	7, 8 1-5, 10-12
X Y	HOPFL, Herbert et al, Study of cyclic borinates obtained from piperidine- and piperazine alcohols by spectroscopic methods and X-ray crystallography, J. Organomet. Chem., 1998, Vol. 553, No. 1-2, pp. 221-239, 特に、第222, 227ページ	8 1-5, 10-12

 C欄の続きにも文献が列挙されている。 パテントファミリーに関する別紙を参照。

## \* 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの  
 「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの  
 「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献(理由を付す)  
 「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献  
 「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

## の日の後に公表された文献

「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日 22.02.00	国際調査報告の発送日 29.02.00	
国際調査機関の名称及びあて先 日本国特許庁 (ISA/JP) 郵便番号 100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官(権限のある職員) 渡邉下美吉 電話番号 03-3581-1101 内線 3452	4C 9284

C (続き) . 関連すると認められる文献		関連する 請求の範囲の番号
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	
X Y	DOROKHOV, V. A. et al, Boron chelate complexes with some enaminones and diketones containing pyridine moiety and their mutual transformation in solutions, Izv. Akad. Nauk, Ser. Khim., 1996, No. 3, pp. 710-714, 特に、第712ページ	7 1-5, 10-12
X Y	Yuan, Guo-Zheng et al, Single site transarylation of 2,2'-dimetalized 1,1'-binaphthyl to aminochloroborates and synthesis of 2-binaphthyl boron compounds, Youji Huaxue, 1996, Vol. 16, No. 2, pp. 139-144, 特に、139, 140ページ	6 1-5, 10-12
X Y	U.S. 5 3 4 8 9 4 7, A (PATEL, Bomi P.) 20. 9月. 1994 (20. 09. 94) ファミリーなし 文献全体	7 1-5, 10-12
X Y	U.S. 5 3 4 8 9 4 7, A (PATEL, Bomi P.) 20. 9月. 1994 (20. 09. 94) ファミリーなし 文献全体	7 1-5, 10-12
X Y	TORRES, Luis Alfonso et al, Rotating-bomb combustion calorimetry and the standard enthalpies of formation of two borinic esters, J. Chem. Thermodyn. Vol. 1994, No. 26, No. 4, pp. 337-43, 特に、第338ページ	7, 9 1-5, 10-12
X Y	FARFAN, Norberto et al, Through-bond modulation of N-fwdrw. B ring formation shown by NMR and x-ray diffraction studies of borate derivatives of pyridyl alcohols, J. Chem. Soc., Perkin Trans. 2, 1992, No. 4, pp. 527-32, 特に、第527ページ	7, 9 1-5, 10-12
X Y	LIU, Xiaolan et al, Structure studies of bis(substituted)-2-(substituted)-8-hydroxyquinolines, Youji Huaxue, 1991, Vol. 11, No. 4, pp. 410-15, 特に、第412, 414ページ	6 1-5, 10-12
X Y	SHAN, Zixing et al, Synthesis of aromatic nitrogen-containing heterocyclic derivatives of asymmetric diarylborinic acids, Wuhan Daxue Xuebao, Ziran Kexueban, 1990, No. 3, pp. 67-72, 特に、第68ページ	6, 7 1-5, 10-12
X Y	YUAN, Guozheng et al, Ligand substitution reaction of diarylboron chelates, Wuji Huaxue Xuebao, 1990, Vol. 6, No. 3, pp. 314-18, 特に、第314, 315ページ	6 1-5, 10-12
X Y	YUAN, Guozheng et al, Studies on antitumor boron compounds. V. Fluorine- and methoxy-substituted diphenylboron chelates with N,O-bidentate ligands, Youji Huaxue, 1989, Vol. 9, No. 3, pp. 226-9, 特に、第227ページ	6 1-5, 10-12
X Y	YUAN, Guozheng et al, Boron compounds. XX. Synthesis and conversion of ethanolamine-tri(2-furyl)borane, Youji Huaxue 1987, No. 2, pp. 146-9, 特に、第148ページ	6 1-5, 10-12
X Y	MOEHRLE, H. et al, Concurrent reaction of the phenol and the 1,3-dicarbonyl function under Mannich conditions, Pharmazie, 1985, Vol. 40, No. 11, pp. 767-71, 特に、第767ページ	6 1-5, 10-12

C(続き)	関連すると認められる文献	関連する 請求の範囲の番号
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	
X Y	MOEHRLE, H. et al, Reaction of functional epoxycarbonyl compounds opposed to hydrogen chloride, Pharmazie, 1985, Vol. 40, No. 6, pp. 387-93, 特に、第389ページ	6 1-5, 10-12
X Y	MOEHRLE, H. et al, Real structures of drugs seemingly derived from 1-(8-hydroxyquinol-5-yl)-3-phenylpropane-1,3-dione, Pharmazie, 1985, Vol. 40, No. 5, pp. 307-11, 特に、第309ページ	6 1-5, 10-12
X Y	LIN, Kai et al, Synthesis and antitumor activity of organyloxy-diarylborane chelates containing quinoline ring, Yiyao Gongye, 1985, Vol. 16, No. 11, pp. 500-2, 特に、第501ページ	6 1-5, 10-12
X Y	BAILEY, P. J. et al, Boron-containing antibacterial agents: effects on growth and morphology of bacteria under various culture conditions, Antimicrob. Agents Chemother., 1980, Vol. 17, No. 4, pp. 549-53, 特に、Fig. 1.	6, 10 1-5, 11, 12
X Y	MOEHRLE, H. et al, Conformation influences during the dehydrogenation of phenolic Mannich bases, Monatsh. Chem., 1974, Vol. 105, No. 6, pp. 1151-63, 特に、第1156ページ	6 1-5, 10-12
X Y	TITKOV, Yu. B. et al, Luminescence method for determining molybdenum with hydroxyquinoline and sodium tetraphenylborate, Ukr. Khim. Zh., 1970, Vol. 36, No. 6, pp. 613-15, 特に、第614ページ	6 1-5, 10-12
X Y	DOUGLASS, James E. et al, Some bis-amine complexes of boronium ions with bulky substituents of boron, J. Organomet. Chem., 1967, Vol. 8, No. 3, pp. 421-6, 特に、第421ページ	6 1-5, 10-12
Y	DE, 1 6 7 0 4 9 4, A (Chemie Gr. nenthal GmbH) 2 1. 1月. 1 9 7 1 (2 1. 0 1. 7 1) ファミリーなし 第2ページ 第6行-第4ページ	1-12
P X	E P, 9 6 9 5 3 1, A 2 (Bayer Aktiengesellschaft) 0 5. 1月. 2 0 0 0 (0 5. 0 1. 0 0) [0046]-[0079], CLAIM 10 & DE, 1 9 8 2 9 9 4 7, A 1	6